

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2003年12月18日 (18.12.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/103648 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/055, 31/121, 31/15, 31/166,  
31/167, 31/17, 31/18, 31/185, 31/194, 31/216, 31/222,  
31/235, 31/275, 31/341, 31/357, 31/36, 31/381, 31/40,  
31/403, 31/4035, 31/404, 31/415, 31/4164, 31/4188,  
31/421, 31/422, 31/426, 31/427, 31/433, 31/44, 31/4402京区本郷5丁目24番5号 角川本郷ビル4F 株式  
会社医薬分子設計研究所内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/07131

(22) 国際出願日: 2003年6月5日 (05.06.2003)

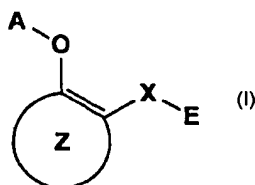
(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-164524 2002年6月5日 (05.06.2002) JP(74) 代理人: 特許業務法人特許事務所サイクス (SIKS &  
CO.); 〒104-0031 東京都中央区京橋一丁目8番7号  
京橋日殖ビル8階 Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,  
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO,  
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,  
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,  
ZA, ZM, ZW.(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社  
医薬分子設計研究所 (INSTITUTE OF MEDICINAL  
MOLECULAR DESIGN, INC.) [JP/JP]; 〒113-0033 東  
京都文京区本郷5丁目24番5号 角川本郷ビル4F  
Tokyo (JP).(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,  
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許  
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,  
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:  
— 国際調査報告書(72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 武藤 進  
(MUTO, Susumu) [JP/JP]; 〒184-0003 東京都小金井市  
緑町1-6-7 メイブルコーポB202 Tokyo (JP).  
板井 昭子 (ITAI, Akiko) [JP/JP]; 〒113-0033 東京都文2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: THERAPEUTIC DRUG FOR DIABETES

(54) 発明の名称: 糖尿病治療薬



(57) Abstract: A medicine for the prevention of and/or treatments for diabetes or complications of diabetes, which contains as an active ingredient a substance selected from the group consisting of a compound represented by the following general formula (I): (I) [wherein X represents a connecting group in which the main chain has 2 to 5 atoms (the group has been optionally substituted); A represents hydrogen or acetyl; E represents optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl; and ring Z represents either arene which may have one or more substituents besides the groups represented by the formula -O-A (wherein A has the same meaning as defined above) and the formula -X-E (wherein X and E have the same meanings as defined above) or heteroarene

which may have one or more substituents besides the groups represented by the formula -O-A (wherein A has the same meaning as defined above) and the formula -X-E (wherein X and E have the same meanings as defined above)], pharmacologically acceptable salts thereof, and hydrates and solvates of these.

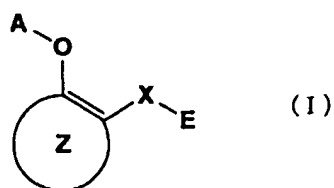
[続葉有]

WO 03/103648 A1



(57) 要約:

下記一般式 (I) :



(式中、

Xは、主鎖の原子数が2ないし5である連結基（該連結基は置換基を有していてもよい）を表し、

Aは、水素原子又はアセチル基を表し、

Eは、置換基を有していてもよいアリール基又は置換基を有していてもよいヘテロアリール基を表し、

環Zは、式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよいアレーン、又は式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよいヘテロアレーンを表す）で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む、糖尿病又は糖尿病の合併症の予防及び／又は治療のための医薬。

## 明 細 書

## 糖尿病治療薬

## 技術分野

本発明は、糖尿病または糖尿病の合併症の予防及び／又は治療のための医薬に関する。

## 背景技術

糖尿病は何らかの原因により糖代謝が異常となり高血糖を来し、この高血糖が原因となって種々の合併症をもたらす疾患であると認識されている。従って、血糖値のコントロールが糖尿病の治療には重要な要因であることは明らかである。現在、血糖値の改善のために、インスリン製剤、ビグアナイド系薬剤、スルホニルウレア系薬剤、チアゾリジンジオン系薬剤等が使われている。しかしながら、インスリン製剤は投与法に難があり、ビグアナイド製剤は最近見直されてきているものの、乳酸アシドーシスを起こしやすいために使いにくいという問題がある。また、スルホニルウレア製剤はインスリンを分泌している膵のランゲルハンス島の $\beta$ 細胞に負担をかける為に長期の使用には適さない。チアゾリジンジオン系薬剤は、この中では唯一インスリン抵抗性を改善する薬剤であるが、この薬剤に対して無反応な患者も多く、体重増加等の問題もある。従って、現在使用されている血糖降下剤では、まだ糖尿病の治療薬としては不十分であると言わざるを得ない。

$IKK-\beta$  ( $I\kappa B$  キナーゼ $\beta$  または  $I\kappa B$  キナーゼ 2) はセリノースレオニンキナーゼと呼ばれるプロテインキナーゼの一種で、 $NF-\kappa B$  の活性化に関与していることが知られているが、近年になってリン酸化を受けて活性化された  $IKK-\beta$  がインスリン抵抗性に深く関与していることが示唆された。すなわち、CD36 レセプターに血中の遊離脂肪酸が結合すると、 $PKC-\theta$  (プロテインキナーゼ C-

θ) が活性化される。それがさらに I K K-β を活性化し、活性化された I K K-β が IRS-1 (Insulin receptor substrate-1) をリン酸化することによりインスリンレセプターからのシグナル伝達を阻害するというものである。実際にインスリン抵抗性を示すマウスに I K K-β の選択阻害剤として知られているアスピリンまたはサリチル酸を高用量で投与するとインスリン抵抗性が改善したという報告がある (「ジャーナル・オブ・クリニカル・インベスティゲーション (Journal of Clinical Investigation)」, (米国), 2001 年, 第 108 巻, 第 3 号, p. 437-446; 「サイエンス (Science)」, (米国), 2001 年, 第 293 巻, p. 1673-1677)。しかしながら、アスピリンまたはサリチル酸はインスリン抵抗性を改善するための薬剤としては作用が不十分である。

一方、N-置換サリチルアミド誘導体、とりわけ N-フェニルサリチルアミド誘導体は、米国特許第 4358443 号明細書に植物成長阻害剤として開示されており、医薬としては欧州特許第 0221211 号明細書、特開昭 62-99329 号公報、及び米国特許第 6117859 号明細書に抗炎症剤としての記載がある。また、国際公開第 99/65499 号パンフレット、国際公開第 02/49632 号パンフレット、及び国際公開第 02/076918 号パンフレットには NF-κB 阻害剤として、国際公開第 02/051397 号パンフレットにはサイトカイン産生抑制剤として開示されている。

#### 発明の開示

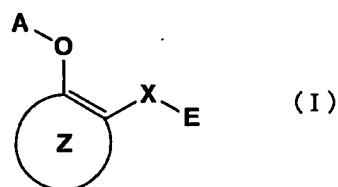
本発明の課題は、I K K-β を特異的に阻害することによりインスリン抵抗性を改善する薬剤を提供することにある。本発明者らは、上記の課題を解決すべく、コンピューター利用の分子設計技術により I K K-β 選択的阻害剤の探索を実施した。P D B (Protein Data Bank) に構造が登録されているプロテインキナーゼより I K K-β と相同性の高い適切なものを選抜し、それを鋳型としてホモロジーモデリングの手法を用いて I K K-β の立体構造モデルを構築し、タンパク質への薬物分子の結合様式の自動探索プログラムを用い、アスピリンの I K K-β

のATP結合領域への結合様式と特徴的な分子間相互作用を解析した。

その結果に基づいて、リガンドのタンパク質立体構造に基づく化合物3次元データベース自動検索プログラムを用い、Sigma-Aldrich社、Aldrich社、Maybridge社、Specsy社、Bionet社、Labotest社、Lancaster社、Tocris社、東京化成、和光純薬等で市販されている化合物データベースに登録されている化合物の中からヴァーチャルスクリーニングによりIKK- $\beta$ の特異的阻害剤となり得る化合物を選定した。更に最適化のための分子設計を行い、そこから候補化合物として選ばれたヒドロキシアリール誘導体を購入又は合成し、それらのインスリン抵抗性改善作用を検討した結果、N-置換サリチルアミド誘導体、とりわけN-アリールサリチルアミド誘導体が強いインスリン抵抗性改善作用を有することを見出した。本発明は上記の知見を基にして完成されたものである。

すなわち、本発明は、

(1) 下記一般式(I)：



(式中、

Xは、主鎖の原子数が2ないし5である連結基（該連結基は置換基を有していてもよい）を表し、

Aは、水素原子又はアセチル基を表し、

Eは、置換基を有していてもよいアリール基又は置換基を有していてもよいヘテロアリール基を表し、

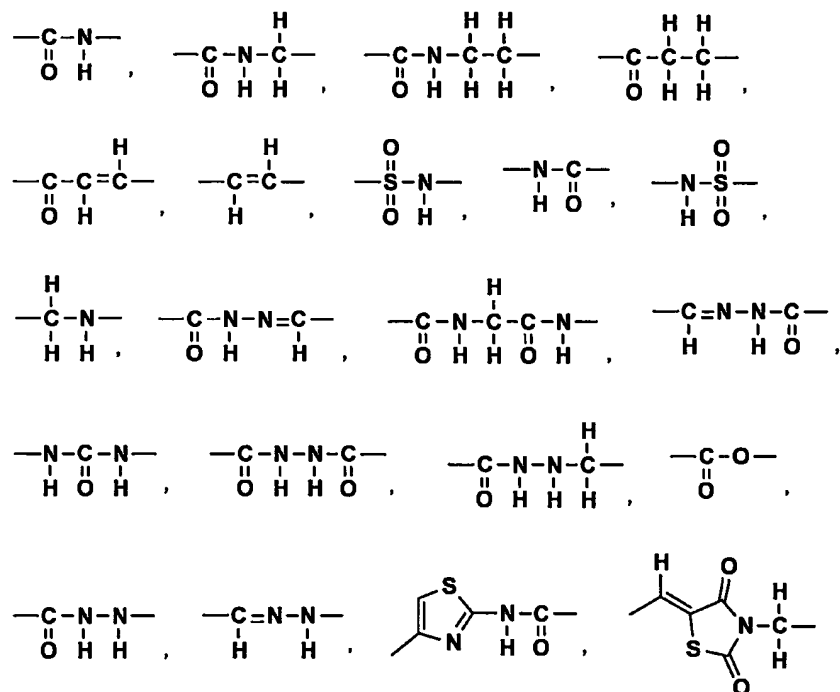
環Zは、式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよいアレーン、又は式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他に更に置換

基を有していてもよいヘテロアレーンを表す) で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む、糖尿病の予防及び／又は治療のための医薬を提供するものである。また、本発明により上記の物質を有効成分として含む、糖尿病の合併症の予防及び／又は治療のための医薬が提供される。

本発明の好適な医薬としては、

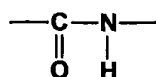
(2) Xが、下記連結基群 $\alpha$ より選択される基(該基は置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

[連結基群 $\alpha$ ] 下記式：



(式中、左側の結合手が環Zに結合し右側の結合手がEに結合する)

(3) Xが、下記式：



(式中、左側の結合手が環Zに結合し右側の結合手がEに結合する) で表される

基（該基は置換基を有していてもよい）である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

（４）Ａが、水素原子である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

（５）環Ｚが、 $C_6 \sim C_{10}$ のアレーン（該アレーンは、式－Ｏ－Ａ（式中、Ａは一般式（Ｉ）における定義と同義である）及び式－Ｘ－Ｅ（式中、Ｘ及びＥは一般式（Ｉ）における定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよい）、又は５ないし１３員のヘテロアレーン（該ヘテロアレーンは、式－Ｏ－Ａ（式中、Ａは一般式（Ｉ）における定義と同義である）及び式－Ｘ－Ｅ（式中、Ｘ及びＥは一般式（Ｉ）における定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよい）である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

（６）環Ｚが、下記環群β：

〔環群β〕ベンゼン環、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環、インドール環、キノキサリン環、及びカルバゾール環

より選択される環（該環は、式－Ｏ－Ａ（式中、Ａは一般式（Ｉ）における定義と同義である）及び式－Ｘ－Ｅ（式中、Ｘ及びＥは一般式（Ｉ）における定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよい）である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

（７）環Ｚが、式－Ｏ－Ａ（式中、Ａは一般式（Ｉ）における定義と同義である）及び式－Ｘ－Ｅ（式中、Ｘ及びＥは一般式（Ｉ）における定義と同義である）で表される基の他に更に置換基を有していてもよいベンゼン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から

選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(8) 環 Z が、式-O-A (式中、A は一般式 (I) における定義と同義である) 及び式-X-E (式中、X 及び E は一般式 (I) における定義と同義である) で表される基の他にハロゲン原子を更に有するベンゼン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(9) 環 Z が、式-O-A (式中、A は一般式 (I) における定義と同義である) 及び式-X-E (式中、X 及び E は一般式 (I) における定義と同義である) で表される基の他に置換基を更に有していてもよいナフタレン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(10) E が、置換基を有していてもよい  $C_6 \sim C_{10}$  のアリール基、又は置換基を有していてもよい 5 ないし 13 員のヘテロアリール基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(11) E が、置換基を有していてもよいフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(12) E が、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(13) E が、置換基を有していてもよい 5 員のヘテロアリール基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬を挙げることができる。

別の観点からは、本発明により、上記の (1) ~ (13) の医薬の製造のための上記の各物質の使用が提供される。

また、本発明により、ヒトを含む哺乳類動物において、糖尿病又は糖尿病の合併



症を予防及び／又は治療する方法であつて、上記の物質の予防及び／又は治療有効量をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法が提供される。

発明を実施するための最良の形態

本発明の理解のために「国際公開第02/49632号パンフレット」の開示を参照することは有用である。上記「国際公開第02/49632号パンフレット」の開示の全てを参照として本明細書の開示に含める。

本明細書において用いられる用語の意味は以下の通りである。

「ハロゲン原子」としては、特に言及する場合を除き、弗素原子、塩素原子、臭素原子、又は沃素原子のいずれを用いてもよい。

「炭化水素基」としては、例えば、脂肪族炭化水素基、アリール基、アリーレン基、アラルキル基、架橋環式炭化水素基、スピロ環式炭化水素基、及びテルペン系炭化水素等が挙げられる。

「脂肪族炭化水素基」としては、例えば、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキレン基、アルケニレン基、アルキリデン基等の直鎖状又は分枝鎖状の1価若しくは2価の非環式炭化水素基；シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカンジエニル基、シクロアルキル-アルキル基、シクロアルキレン基、シクロアルケニレン基等の飽和又は不飽和の1価若しくは2価の脂環式炭化水素基等が挙げられる。

「アルキル基」としては、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、2-メチルブチル、1-メチルブチル、ネオペンチル、1, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、*n*-ヘキシル、4-メチルペンチル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、2-エチルブチル、1-エチルブチル、1-エチル-1-メチルプロピル、*n*-ヘプチル、

n-オクチル、n-ノニル、n-デシル、n-ウンデシル、n-ドデシル、n-トリデシル、n-テトラデシル、n-ペンタデシル等のC<sub>1</sub>~C<sub>15</sub>の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基が挙げられる。

「アルケニル基」としては、例えば、ビニル、プロパー1-エン-1-イル、アリル、イソプロペニル、ブター1-エン-1-イル、ブター2-エン-1-イル、ブター3-エン-1-イル、2-メチルプロパー2-エン-1-イル、1-メチルプロパー2-エン-1-イル、ペンター1-エン-1-イル、ペンター2-エン-1-イル、ペンター3-エン-1-イル、ペンター4-エン-1-イル、3-メチルブター2-エン-1-イル、3-メチルブター3-エン-1-イル、ヘキサー1-エン-1-イル、ヘキサー2-エン-1-イル、ヘキサー3-エン-1-イル、ヘキサー4-エン-1-イル、ヘキサー5-エン-1-イル、4-メチルペンター3-エン-1-イル、4-メチルペンター3-エン-1-イル、ヘプター1-エン-1-イル、ヘプター6-エン-1-イル、オクター1-エン-1-イル、オクター7-エン-1-イル、ノナー1-エン-1-イル、ノナー8-エン-1-イル、デカー1-エン-1-イル、デカー9-エン-1-イル、ウンデカー1-エン-1-イル、ウンデカー10-エン-1-イル、ドデカー1-エン-1-イル、ドデカー11-エン-1-イル、トリデカー1-エン-1-イル、トリデカー12-エン-1-イル、テトラデカー1-エン-1-イル、テトラデカー13-エン-1-イル、ペンタデカー1-エン-1-イル、ペンタデカー14-エン-1-イル等のC<sub>2</sub>~C<sub>15</sub>の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル基が挙げられる。

「アルキニル基」としては、例えば、エチニル、プロパー1-イン-1-イル、プロパー2-イン-1-イル、ブター1-イン-1-イル、ブター3-イン-1-イル、1-メチルプロパー2-イン-1-イル、ペンター1-イン-1-イル、ペンター4-イン-1-イル、ヘキサー1-イン-1-イル、ヘキサー5-イン-1-イル、ヘプター1-イン-1-イル、ヘプター6-イン-1-イル、オクター1-イン-1-イル、オクター7-イン-1-イル、ノナー1-イン-1-イル

イル、ノナ-8-イン-1-イル、デカ-1-イン-1-イル、デカ-9-イン-1-イル、ウンデカ-1-イン-1-イル、ウンデカ-10-イン-1-イル、ドデカ-1-イン-1-イル、ドデカ-11-イン-1-イル、トリデカ-1-イン-1-イル、トリデカ-12-イン-1-イル、テトラデカ-1-イン-1-イル、テトラデカ-13-イン-1-イル、ペンタデカ-1-イン-1-イル、ペンタデカ-14-イン-1-イル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル基が挙げられる。

「アルキレン基」としては、例えば、メチレン、エチレン、エタン-1, 1-ジイル、プロパン-1, 3-ジイル、プロパン-1, 2-ジイル、プロパン-2, 2-ジイル、ブタン-1, 4-ジイル、ペンタン-1, 5-ジイル、ヘキサ-1, 6-ジイル、1, 1, 4, 4-テトラメチルブタン-1, 4-ジイル等の $C_1 \sim C_8$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

「アルケニレン基」としては、例えば、エテン-1, 2-ジイル、プロペン-1, 3-ジイル、ブタ-1-エン-1, 4-ジイル、ブタ-2-エン-1, 4-ジイル、2-メチルプロペン-1, 3-ジイル、ペンタ-2-エン-1, 5-ジイル、ヘキサ-3-エン-1, 6-ジイル等の $C_1 \sim C_8$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

「アルキリデン基」としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン等の $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキリデン基が挙げられる。

「シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基が挙げられる。

なお、上記「シクロアルキル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インダニル、2-インダニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル等の基が挙げられる。

「シクロアルケニル基」としては、例えば、2-シクロプロペン-1-イル、2-シクロブテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル、1-シクロブテン-1-イル、1-シクロペンテン-1-イル等の $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニル基が挙げられる。

なお、上記「シクロアルケニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インダニル、2-インダニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、1-インデニル、2-インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルカンジエニル基」としては、例えば、2, 4-シクロペンタンジエン-1-イル、2, 4-シクロヘキサンジエン-1-イル、2, 5-シクロヘキサンジエン-1-イル等の $C_5 \sim C_6$ のシクロアルカンジエニル基が挙げられる。なお、上記「シクロアルカンジエニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インデニル、2-インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が、「シクロアルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、2-シクロプロピルエチル、3-シクロプロピルプロピル、4-シクロプロピルブチル、5-シクロプロピルペンチル、6-シクロプロピルヘキシル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘプチルメチル、シクロオクチルメチル、6-シクロオクチルヘキシル等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル基が挙げられる。

「シクロアルキレン基」としては、例えば、シクロプロパン-1, 1-ジイル、シクロプロパン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 1-ジイル、シクロブタン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 3-ジイル、シクロペンタン-1, 1

ージイル、シクロペンタンー1, 2ージイル、シクロペンタンー1, 3ージイル、シクロヘキサンー1, 1ージイル、シクロヘキサンー1, 2ージイル、シクロヘキサンー1, 3ージイル、シクロヘキサンー1, 4ージイル、シクロヘプタンー1, 1ージイル、シクロヘプタンー1, 2ージイル、シクロオクタンー1, 1ージイル、シクロオクタンー1, 2ージイル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキレン基が挙げられる。

「シクロアルケニレン基」としては、例えば、2ーシクロプロペンー1, 1ージイル、2ーシクロブテンー1, 1ージイル、2ーシクロペンテンー1, 1ージイル、3ーシクロペンテンー1, 1ージイル、2ーシクロヘキセンー1, 1ージイル、2ーシクロヘキセンー1, 2ージイル、2ーシクロヘキセンー1, 4ージイル、3ーシクロヘキセンー1, 1ージイル、1ーシクロブテンー1, 2ージイル、1ーシクロペンテンー1, 2ージイル、1ーシクロヘキセンー1, 2ージイル等の $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニレン基が挙げられる。

「アリール基」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素基が挙げられ、例えば、フェニル、1ーナフチル、2ーナフチル、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基が挙げられる。

なお、上記「アリール基」は、上記「 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基」、「 $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニル基」、又は「 $C_5 \sim C_6$ のシクロアルカンジエニル基」等と縮環していてもよく、例えば、4ーインダニル、5ーインダニル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレンー5ーイル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレンー6ーイル、3ーアセナフテニル、4ーアセナフテニル、インデンー4ーイル、インデンー5ーイル、インデンー6ーイル、インデンー7ーイル、4ーフェナレニル、5ーフェナレニル、6ーフェナレニル、7ーフェナレニル、8ーフェナレニル、9ーフェナレニル等の基が挙げられる。

「アリーレン基」としては、例えば、1, 2ーフェニレン、1, 3ーフェニレン、1, 4ーフェニレン、ナフタレンー1, 2ージイル、ナフタレンー1, 3ージイル、ナフタレンー1, 4ージイル、ナフタレンー1, 5ージイル、ナフタレンー

1, 6-ジイル、ナフタレン-1, 7-ジイル、ナフタレン-1, 8-ジイル、ナフタレン-2, 3-ジイル、ナフタレン-2, 4-ジイル、ナフタレン-2, 5-ジイル、ナフタレン-2, 6-ジイル、ナフタレン-2, 7-ジイル、ナフタレン-2, 8-ジイル、アントラセン-1, 4-ジイル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリーレン基が挙げられる。

「アラルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が、「アリアル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ベンジル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチル、アントラセニルメチル、フェナントレニルメチル、アセナフチレニルメチル、ジフェニルメチル、1-フェネチル、2-フェネチル、1-(1-ナフチル)エチル、1-(2-ナフチル)エチル、2-(1-ナフチル)エチル、2-(2-ナフチル)エチル、3-フェニルプロピル、3-(1-ナフチル)プロピル、3-(2-ナフチル)プロピル、4-フェニルブチル、4-(1-ナフチル)ブチル、4-(2-ナフチル)ブチル、5-フェニルペンチル、5-(1-ナフチル)ペンチル、5-(2-ナフチル)ペンチル、6-フェニルヘキシル、6-(1-ナフチル)ヘキシル、6-(2-ナフチル)ヘキシル等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基が挙げられる。

「架橋環式炭化水素基」としては、例えば、ビシクロ[2. 1. 0]ペンチル、ビシクロ[2. 2. 1]ヘプチル、ビシクロ[2. 2. 1]オクチル、アダマンチル等の基が挙げられる。

「スピロ環式炭化水素基」としては、例えば、スピロ[3. 4]オクチル、スピロ[4. 5]デカー-1, 6-ジエニル等の基が挙げられる。

「テルペン系炭化水素」としては、例えば、ゲラニル、ネリル、リナリル、フィチル、メンチル、ボルニル等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が「ハロゲン原子」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、ジブロモメチル、トリブロモメチル、ヨードメチル、ジヨードメ

チル、トリヨードメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロブチル、パーフルオロヘキシル等の1乃至13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキル基が挙げられる。

「ヘテロ環基」としては、例えば、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1乃至3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式ヘテロアリアル基、並びに、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1乃至3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

「単環式ヘテロアリアル基」としては、例えば、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、5-イミダゾリル、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、(1, 2, 3-オキサジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-オキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 4-オキサジアゾール)-3-イル、(1, 2, 4-オキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 5-オキサジアゾール)-3-イル、(1, 2, 5-オキサジアゾール)-4-イル、(1, 3, 4-オキサジアゾール)-2-イル、(1, 3, 4-オキサジアゾール)-5-イル、フラザニル、(1, 2, 3-チアジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-チアジアゾール)-5-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール)-3-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール)-5-イル、(1, 2, 5-チアジアゾール)-3-イル、(1, 2, 5-チアジアゾール)-4-イル、(1, 3, 4-チアジアゾリル)-2-イル、(1, 3, 4-チアジ

アゾリル) - 5-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール) - 1-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール) - 4-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール) - 5-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール) - 2-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール) - 4-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール) - 1-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール) - 3-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール) - 5-イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール) - 3-イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール) - 4-イル、(1H-テトラゾール) - 1-イル、(1H-テトラゾール) - 5-イル、(2H-テトラゾール) - 2-イル、(2H-テトラゾール) - 5-イル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、(1, 2, 3-トリアジン) - 4-イル、(1, 2, 3-トリアジン) - 5-イル、(1, 2, 4-トリアジン) - 3-イル、(1, 2, 4-トリアジン) - 5-イル、(1, 2, 4-トリアジン) - 6-イル、(1, 3, 5-トリアジン) - 2-イル、1-アゼピニル、1-アゼピニル、2-アゼピニル、3-アゼピニル、4-アゼピニル、(1, 4-オキサゼピン) - 2-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 3-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 5-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 6-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 7-イル、(1, 4-チアゼピン) - 2-イル、(1, 4-チアゼピン) - 3-イル、(1, 4-チアゼピン) - 5-イル、(1, 4-チアゼピン) - 6-イル、(1, 4-チアゼピン) - 7-イル等の5乃至7員の単環式ヘテロアリール基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリール基」としては、例えば、2-ベンゾフラニル、3-ベンゾフラニル、4-ベンゾフラニル、5-ベンゾフラニル、6-ベンゾフラニル、7-ベンゾフラニル、1-イソベンゾフラニル、4-イソベンゾフラニル、5-イソベンゾフラニル、2-ベンゾ[b]チエニル、3-ベンゾ[b]チエニル、4-ベンゾ[b]チエニル、5-ベンゾ[b]チエニル、6-ベンゾ[b]チエニル、7-ベンゾ[b]チエニル、1-ベンゾ[c]チエニル、4-ベンゾ[c]チエニル、5-ベンゾ[c]チエニル、1-インドリル、1-インドリル、



2-インドリル、3-インドリル、4-インドリル、5-インドリル、6-インドリル、7-インドリル、(2H-イソインドール)-1-イル、(2H-イソインドール)-2-イル、(2H-イソインドール)-4-イル、(2H-イソインドール)-5-イル、(1H-インダゾール)-1-イル、(1H-インダゾール)-3-イル、(1H-インダゾール)-4-イル、(1H-インダゾール)-5-イル、(1H-インダゾール)-6-イル、(1H-インダゾール)-7-イル、(2H-インダゾール)-1-イル、(2H-インダゾール)-2-イル、(2H-インダゾール)-4-イル、(2H-インダゾール)-5-イル、2-ベンゾオキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、4-ベンゾオキサゾリル、5-ベンゾオキサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、7-ベンゾオキサゾリル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール)-3-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール)-4-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール)-5-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール)-6-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール)-7-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール)-3-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール)-4-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール)-5-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール)-6-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール)-7-イル、2-ベンゾチアゾリル、4-ベンゾチアゾリル、5-ベンゾチアゾリル、6-ベンゾチアゾリル、7-ベンゾチアゾリル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-3-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-4-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-5-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-6-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-7-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール)-3-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール)-4-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール)-5-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール)-6-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール)-7-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール)-6-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール)-7-イル、(2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール)-4-イル、(2, 1, 3

-ベンゾオキサジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール)  
 - 4-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-  
 ベンゾチアジアゾール) - 6-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 7-  
 -イル、(2, 1, 3-ベンゾチアジアゾール) - 4-イル、(2, 1, 3-ベン  
 ゾチアジアゾール) - 5-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 1-イル、(1  
 H-ベンゾトリアゾール) - 4-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 5-イル、  
 (1H-ベンゾトリアゾール) - 6-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 7-  
 イル、(2H-ベンゾトリアゾール) - 2-イル、(2H-ベンゾトリアゾール)  
 - 4-イル、(2H-ベンゾトリアゾール) - 5-イル、2-キノリル、3-キノ  
 リル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリ  
 ル、1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、5-イソキノリ  
 ル、6-イソキノリル、7-イソキノリル、8-イソキノリル、3-シンノリニ  
 ル、4-シンノリニル、5-シンノリニル、6-シンノリニル、7-シンノリニ  
 ル、8-シンノリニル、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、5-キナゾリニ  
 ル、6-キナゾリニル、7-キナゾリニル、8-キナゾリニル、2-キノキサリ  
 ニル、5-キノキサリニル、6-キノキサリニル、1-フタラジニル、5-フタ  
 ラジニル、6-フタラジニル、2-ナフチリジニル、3-ナフチリジニル、4-  
 ナフチリジニル、2-プリニル、6-プリニル、7-プリニル、8-プリニル、  
 2-プテリジニル、4-プテリジニル、6-プテリジニル、7-プテリジニル、  
 1-カルバゾリル、2-カルバゾリル、3-カルバゾリル、4-カルバゾリル、  
 9-カルバゾリル、2-( $\alpha$ -カルボリニル)、3-( $\alpha$ -カルボリニル)、4-  
 ( $\alpha$ -カルボリニル)、5-( $\alpha$ -カルボリニル)、6-( $\alpha$ -カルボリニル)、7-  
 ( $\alpha$ -カルボリニル)、8-( $\alpha$ -カルボリニル)、9-( $\alpha$ -カルボリニル)、  
 1-( $\beta$ -カルボニリル)、3-( $\beta$ -カルボニリル)、4-( $\beta$ -カルボニリル)、  
 5-( $\beta$ -カルボニリル)、6-( $\beta$ -カルボニリル)、7-( $\beta$ -カルボニリル)、  
 8-( $\beta$ -カルボニリル)、9-( $\beta$ -カルボニリル)、1-( $\gamma$ -カルボリニル)、  
 2-( $\gamma$ -カルボリニル)、4-( $\gamma$ -カルボリニル)、5-( $\gamma$ -カルボリニル)、

6-( $\gamma$ -カルボリニル)、7-( $\gamma$ -カルボリニル)、8-( $\gamma$ -カルボリニル)、  
 9-( $\gamma$ -カルボリニル)、1-アクリジニル、2-アクリジニル、3-アクリジ  
 ニル、4-アクリジニル、9-アクリジニル、1-フェノキサジニル、2-フェ  
 ノキサジニル、3-フェノキサジニル、4-フェノキサジニル、10-フェノキ  
 サジニル、1-フェノチアジニル、2-フェノチアジニル、3-フェノチアジニ  
 ル、4-フェノチアジニル、10-フェノチアジニル、1-フェナジニル、2-  
 フェナジニル、1-フェナントリジニル、2-フェナントリジニル、3-フェナ  
 ントリジニル、4-フェナントリジニル、6-フェナントリジニル、7-フェナ  
 ントリジニル、8-フェナントリジニル、9-フェナントリジニル、10-フェ  
 ナントリジニル、2-フェナントロリニル、3-フェナントロリニル、4-フェ  
 ナントロリニル、5-フェナントロリニル、6-フェナントロリニル、7-フェ  
 ナントロリニル、8-フェナントロリニル、9-フェナントロリニル、10-フ  
 ェナントロリニル、1-チアントレニル、2-チアントレニル、1-インドリジ  
 ニル、2-インドリジニル、3-インドリジニル、5-インドリジニル、6-イ  
 ンドリジニル、7-インドリジニル、8-インドリジニル、1-フェノキサチイ  
 ニル、2-フェノキサチイニル、3-フェノキサチイニル、4-フェノキサチイ  
 ニル、チエノ〔2, 3-b〕フリル、ピロロ〔1, 2-b〕ピリダジニル、ピラ  
 ゾロ〔1, 5-a〕ピリジル、イミダゾ〔1 1, 2-a〕ピリジル、イミダゾ〔1,  
 5-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 2-b〕ピリダジニル、イミダゾ〔1, 2-  
 a〕ピリミジニル、1, 2, 4-トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジル、1, 2,  
 4-トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリダジニル等の8乃至14員の縮合多環式ヘテ  
 ロアリール基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環基」としては、例えば、1-アジリジニル、1-アゼチ  
 ジニル、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、2-テトラ  
 ヒドロフリル、3-テトラヒドロフリル、チオラニル、1-イミダゾリジニル、  
 2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1-ピラゾリジニル、3-ピラ  
 ザリジニル、4-ピラゾリジニル、1-(2-ピロリニル)、1-(2-イミダゾ

リニル)、2-(2-イミダゾリニル)、1-(2-ピラゾリニル)、3-(2-ピラゾリニル)、ピペリジノ、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1-ホモピペリジニル、2-テトラヒドロピラニル、モルホリノ、(チオモルホリン)-4-イル、1-ピペラジニル、1-ホモピペラジニル等の3乃至7員の飽和若しくは不飽和の単環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環基」としては、例えば、2-キヌクリジニル、2-クロマニル、3-クロマニル、4-クロマニル、5-クロマニル、6-クロマニル、7-クロマニル、8-クロマニル、1-イソクロマニル、3-イソクロマニル、4-イソクロマニル、5-イソクロマニル、6-イソクロマニル、7-イソクロマニル、8-イソクロマニル、2-チオクロマニル、3-チオクロマニル、4-チオクロマニル、5-チオクロマニル、6-チオクロマニル、7-チオクロマニル、8-チオクロマニル、1-イソチオクロマニル、3-イソチオクロマニル、4-イソチオクロマニル、5-イソチオクロマニル、6-イソチオクロマニル、7-イソチオクロマニル、8-イソチオクロマニル、1-インドリニル、2-インドリニル、3-インドリニル、4-インドリニル、5-インドリニル、6-インドリニル、7-インドリニル、1-イソインドリニル、2-イソインドリニル、4-イソインドリニル、5-イソインドリニル、2-(4H-クロメニル)、3-(4H-クロメニル)、4-(4H-クロメニル)、5-(4H-クロメニル)、6-(4H-クロメニル)、7-(4H-クロメニル)、8-(4H-クロメニル)、1-イソクロメニル、3-イソクロメニル、4-イソクロメニル、5-イソクロメニル、6-イソクロメニル、7-イソクロメニル、8-イソクロメニル、1-(1H-ピロリジニル)、2-(1H-ピロリジニル)、3-(1H-ピロリジニル)、5-(1H-ピロリジニル)、6-(1H-ピロリジニル)、7-(1H-ピロリジニル)等の8乃至10員の飽和若しくは不飽和の縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

上記「ヘテロ環基」の中で、環系を構成する原子(環原子)として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ

原子 1 乃至 3 種を有していてもよい単環式又は縮合多環式ヘテロアリアル基、並びに、環系を構成する原子（環原子）として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子 1 乃至 3 種を有していてもよい単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基を「環状アミノ基」と称し、例えば、1-ピロリジニル、1-イミダゾリジニル、1-ピラゾリジニル、1-オキサゾリジニル、1-チアゾリジニル、ピペリジノ、モルホリノ、1-ピペラジニル、チオモルホリン-4-イル、1-ホモピペリジニル、1-ホモピペラジニル、2-ピロリン-1-イル、2-イミダゾリン-1-イル、2-ピラゾリン-1-イル、1-インドリニル、2-イソインドリニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル、1-ピロリル、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-インドリル、1-インダゾリル、2-イソインドリル等の基が挙げられる。

上記「シクロアルキル基」、「シクロアルケニル基」、「シクロアルカンジエニル基」、「アリアル基」、「シクロアルキレン基」、「シクロアルケニレン基」、「アリーレン基」、「架橋環式炭化水素基」、「スピロ環式炭化水素基」、及び「ヘテロ環基」を総称して「環式基」と称する。また、該「環式基」の中で、特に「アリアル基」、「アリーレン基」、「単環式ヘテロアリアル基」、及び「縮合多環式ヘテロアリアル基」を総称して「芳香環式基」と称する。

「炭化水素-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素-オキシ基」としては、例えば、アルコキシ基（アルキル-オキシ基）、アルケニル-オキシ基、アルキニル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-アルキル-オキシ基等の脂肪族炭化水素-オキシ基；アリール-オキシ基；アラルキル-オキシ基；アルキレン-ジオキシ基等が挙げられる。

「アルコキシ基（アルキル-オキシ基）」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブト

キシ、tert-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、2-メチルブトキシ、1-メチルブトキシ、ネオペンチルオキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、n-ヘキシルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、1-メチルペンチルオキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1-エチルブトキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、n-ヘプチルオキシ、n-オクチルオキシ、n-ノニルオキシ、n-デシルオキシ、n-ウンデシルオキシ、n-ドデシルオキシ、n-トリデシルオキシ、n-テトラデシルオキシ、n-ペンタデシルオキシ等のC<sub>1</sub>~C<sub>15</sub>の直鎖状又は分枝鎖状のアルコキシ基が挙げられる。

「アルケニル-オキシ基」としては、例えば、ビニルオキシ、(プロパー-1-エン-1-イル) オキシ、アリルオキシ、イソプロペニルオキシ、(ブター-1-エン-1-イル) オキシ、(ブター-2-エン-1-イル) オキシ、(ブター-3-エン-1-イル) オキシ、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル) オキシ、(1-メチルプロパー-2-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-1-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-2-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-3-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-4-エン-1-イル) オキシ、(3-メチルブター-2-エン-1-イル) オキシ、(3-メチルブター-3-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-1-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-2-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-3-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-4-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-5-エン-1-イル) オキシ、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) オキシ、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) オキシ、(ヘプター-1-エン-1-イル) オキシ、(ヘプター-6-エン-1-イル) オキシ、(オクター-1-エン-1-イル) オキシ、(オクター-7-エン-1-イル) オキシ、(ノナー-1-エン-1-イル) オキシ、(ノナー-8-エン-1-イル) オキシ、(デカー-1-エン-1-イル) オキシ、(デカー-9-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー-1-エン-1-イル)

オキシ、(ウンデカー10-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー1-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー11-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー1-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー12-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー1-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー13-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー1-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー14-エン-1-イル) オキシ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル-オキシ基が挙げられる。

「アルキニル-オキシ基」としては、例えば、エチニルオキシ、(プロパー1-イン-1-イル) オキシ、(プロパー2-イン-1-イル) オキシ、(ブター1-イン-1-イル) オキシ、(ブター3-イン-1-イル) オキシ、(1-メチルプロパー2-イン-1-イル) オキシ、(ペンター1-イン-1-イル) オキシ、(ペンター4-イン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-1-イン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-5-イン-1-イル) オキシ、(ヘプター1-イン-1-イル) オキシ、(ヘプター6-イン-1-イル) オキシ、(オクター1-イン-1-イル) オキシ、(オクター7-イン-1-イル) オキシ、(ノナ-1-イン-1-イル) オキシ、(ノナ-8-イン-1-イル) オキシ、(デカー1-イン-1-イル) オキシ、(デカー9-イン-1-イル) オキシ、(ウンデカー1-イン-1-イル) オキシ、(ウンデカー10-イン-1-イル) オキシ、(ドデカー1-イン-1-イル) オキシ、(ドデカー11-イン-1-イル) オキシ、(トリデカー1-イン-1-イル) オキシ、(トリデカー12-イン-1-イル) オキシ、(テトラデカー1-イン-1-イル) オキシ、(テトラデカー13-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー1-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー14-イン-1-イル) オキシ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル-オキシ基が挙げられる。

「シクロアルキル-オキシ基」としては、例えば、シクロプロポキシ、シクロブトキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロヘプチルオキシ、シクロオクチルオキシ等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル-オキシ基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル-オキシ基」としては、例えば、シクロプロピルメ

トキシ、1-シクロプロピルエトキシ、2-シクロプロピルエトキシ、3-シクロプロピルプロポキシ、4-シクロプロピルブトキシ、5-シクロプロピルペンチルオキシ、6-シクロプロピルヘキシルオキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロヘキシルメトキシ、2-シクロヘキシルエトキシ、3-シクロヘキシルプロポキシ、4-シクロヘキシルブトキシ、シクロヘプチルメトキシ、シクロオクチルメトキシ、6-シクロオクチルヘキシルオキシ等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル-オキシ基が挙げられる。

「アリール-オキシ基」としては、例えば、フェノキシ、1-ナフチルオキシ、2-ナフチルオキシ、アントリルオキシ、フェナントリルオキシ、アセナフチレニルオキシ等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール-オキシ基が挙げられる。

「アラルキル-オキシ基」としては、例えば、ベンジルオキシ、1-ナフチルメトキシ、2-ナフチルメトキシ、アントラセニルメトキシ、フェナントレニルメトキシ、アセナフチレニルメトキシ、ジフェニルメトキシ、1-フェネチルオキシ、2-フェネチルオキシ、1-(1-ナフチル)エトキシ、1-(2-ナフチル)エトキシ、2-(1-ナフチル)エトキシ、2-(2-ナフチル)エトキシ、3-フェニルプロポキシ、3-(1-ナフチル)プロポキシ、3-(2-ナフチル)プロポキシ、4-フェニルブトキシ、4-(1-ナフチル)ブトキシ、4-(2-ナフチル)ブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、5-(1-ナフチル)ペンチルオキシ、5-(2-ナフチル)ペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、6-(1-ナフチル)ヘキシルオキシ、6-(2-ナフチル)ヘキシルオキシ等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル-オキシ基が挙げられる。

「アルキレンジオキシ基」としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、1-メチルメチレンジオキシ、1,1-ジメチルメチレンジオキシ等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルコキシ基 (ハロゲン化アルキル-オキシ基)」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、



例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ヨードメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロイソプロポキシ、ノナフルオロプロトキシ、パーフルオロヘキシルオキシ等の1乃至13個のハロゲン原子で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基が挙げられる。

「ヘテロ環-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環-オキシ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーオキシ基、縮合多環式ヘテロアリールーオキシ基、単環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基等が挙げられる。

「単環式ヘテロアリールーオキシ基」としては、例えば、3-チエニルオキシ、(イソキサゾール-3-イル)オキシ、(チアゾール-4-イル)オキシ、2-ピリジルオキシ、3-ピリジルオキシ、4-ピリジルオキシ、(ピリミジン-4-イル)オキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリールーオキシ基」としては、5-インドリルオキシ、(ベンズイミダゾール-2-イル)オキシ、2-キノリルオキシ、3-キノリルオキシ、4-キノリルオキシ等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基」としては、例えば、3-ピロリジニルオキシ、4-ピペリジニルオキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基」としては、例えば、3-インドリニルオキシ、4-クロマニルオキシ等の基が挙げられる。

「炭化水素-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素-スルファニル基」としては、例えば、アルキル-スルファニル基、アルケニル-スルファニル基、アルキニル-スルファニル

ル基、シクロアルキルースルファニル基、シクロアルキル-アルキルースルファニル基等の脂肪族炭化水素-スルファニル基；アリール-スルファニル基、アラキル-スルファニル基等が挙げられる。

「アルキル-スルファニル基」としては、例えば、メチルスルファニル、エチルスルファニル、*n*-プロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、*n*-ブチルスルファニル、イソブチルスルファニル、*sec*-ブチルスルファニル、*tert*-ブチルスルファニル、*n*-ペンチルスルファニル、イソペンチルスルファニル、(2-メチルブチル)スルファニル、(1-メチルブチル)スルファニル、ネオペンチルスルファニル、(1, 2-ジメチルプロピル)スルファニル、(1-エチルプロピル)スルファニル、*n*-ヘキシルスルファニル、(4-メチルペンチル)スルファニル、(3-メチルペンチル)スルファニル、(2-メチルペンチル)スルファニル、(1-メチルペンチル)スルファニル、(3, 3-ジメチルブチル)スルファニル、(2, 2-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 1-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 2-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 3-ジメチルブチル)スルファニル、(2, 3-ジメチルブチル)スルファニル、(2-エチルブチル)スルファニル、(1-エチルブチル)スルファニル、(1-エチル-1-メチルプロピル)スルファニル、*n*-ヘプチルスルファニル、*n*-オクチルスルファニル、*n*-ノニルスルファニル、*n*-デシルスルファニル、*n*-ウンデシルスルファニル、*n*-ドデシルスルファニル、*n*-トリデシルスルファニル、*n*-テトラデシルスルファニル、*n*-ペンタデシルスルファニル等の $C_1 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル-スルファニル基が挙げられる。

「アルケニル-スルファニル基」としては、例えば、ビニルスルファニル、(プロパー-1-エン-1-イル)スルファニル、アリルスルファニル、イソプロペニルスルファニル、(ブター-1-エン-1-イル)スルファニル、(ブター-2-エン-1-イル)スルファニル、(ブター-3-エン-1-イル)スルファニル、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル)スルファニル、(1-メチルプロパー-2-エン-1-イル)スルファニル、(ペンター-1-エン-1-イル)スルファニル、(ペ

ンター-2-エン-1-イル) スルファニル、(ペンター-3-エン-1-イル) スルファニル、(ペンター-4-エン-1-イル) スルファニル、(3-メチルプター-2-エン-1-イル) スルファニル、(3-メチルプター-3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-1-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-2-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-4-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-5-エン-1-イル) スルファニル、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) スルファニル、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘプター-1-エン-1-イル) スルファニル、(ヘプター-6-エン-1-イル) スルファニル、(オクター-1-エン-1-イル) スルファニル、(オクター-7-エン-1-イル) スルファニル、(ノナ-1-エン-1-イル) スルファニル、(ノナ-8-エン-1-イル) スルファニル、(デカ-1-エン-1-イル) スルファニル、(デカ-9-エン-1-イル) スルファニル、(ウンデカ-1-エン-1-イル) スルファニル、(ウンデカ-10-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-1-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-11-エン-1-イル) スルファニル、(トリデカ-1-エン-1-イル) スルファニル、(トリデカ-12-エン-1-イル) スルファニル、(テトラデカ-1-エン-1-イル) スルファニル、(テトラデカ-13-エン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカ-1-エン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカ-14-エン-1-イル) スルファニル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル-スルファニル基が挙げられる。

「アルキニル-スルファニル基」としては、例えば、エチニルスルファニル、(プロパー-1-イン-1-イル) スルファニル、(プロパー-2-イン-1-イル) スルファニル、(プター-1-イン-1-イル) スルファニル、(プター-3-イン-1-イル) スルファニル、(1-メチルプロパー-2-イン-1-イル) スルファニル、(ペンター-1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンター-4-イン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-5-イン-1-イル) スルファニル、(ヘプター-1-イン-1-イル、(ヘプター-6-イ

ン-1-イル) スルファニル、(オクタ-1-イン-1-イル) スルファニル、(オクタ-7-イン-1-イル) スルファニル、(ノナ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ノナ-8-イン-1-イル) スルファニル、(デカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(デカ-9-イン-1-イル) スルファニル、(ウンデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ウンデカ-10-イン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-11-イン-1-イル) スルファニル、(トリデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(トリデカ-12-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカ-13-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) スルファニル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル-スルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキル-スルファニル基」としては、例えば、シクロプロピルスルファニル、シクロブチルスルファニル、シクロペンチルスルファニル、シクロヘキシルスルファニル、シクロヘプチルスルファニル、シクロオクチルスルファニル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル-スルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル-スルファニル基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) スルファニル、(1-シクロプロピルエチル) スルファニル、(2-シクロプロピルエチル) スルファニル、(3-シクロプロピルプロピル) スルファニル、(4-シクロプロピルブチル) スルファニル、(5-シクロプロピルペンチル) スルファニル、(6-シクロプロピルヘキシル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロペンチルメチル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロペンチルメチル) スルファニル、(シクロヘキシルメチル) スルファニル、(2-シクロヘキシルエチル) スルファニル、(3-シクロヘキシルプロピル) スルファニル、(4-シクロヘキシルブチル) スルファニル、(シクロヘプチルメチル) スルファニル、(シクロオクチルメチル) スルファニル、(6-シクロオクチルヘキシル) スルファニル等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロア

ルキルーアルキルースルファニル基が挙げられる。

「アリールースルファニル基」としては、例えば、フェニルスルファニル、1-ナフチルスルファニル、2-ナフチルスルファニル、アントリルスルファニル、フェナントリルスルファニル、アセナフチレニルスルファニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールースルファニル基が挙げられる。

「アラルキルースルファニル基」としては、例えば、ベンジルスルファニル、(1-ナフチルメチル)スルファニル、(2-ナフチルメチル)スルファニル、(アントラセニルメチル)スルファニル、(フェナントレニルメチル)スルファニル、(アセナフチレニルメチル)スルファニル、(ジフェニルメチル)スルファニル、(1-フェネチル)スルファニル、(2-フェネチル)スルファニル、(1-(1-ナフチル)エチル)スルファニル、(1-(2-ナフチル)エチル)スルファニル、(2-(1-ナフチル)エチル)スルファニル、(2-(2-ナフチル)エチル)スルファニル、(3-フェニルプロピル)スルファニル、(3-(1-ナフチル)プロピル)スルファニル、(3-(2-ナフチル)プロピル)スルファニル、(4-フェニルブチル)スルファニル、(4-(1-ナフチル)ブチル)スルファニル、(4-(2-ナフチル)ブチル)スルファニル、(5-フェニルペンチル)スルファニル、(5-(1-ナフチル)ペンチル)スルファニル、(5-(2-ナフチル)ペンチル)スルファニル、(6-フェニルヘキシル)スルファニル、(6-(1-ナフチル)ヘキシル)スルファニル、(6-(2-ナフチル)ヘキシル)スルファニル等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキルースルファニル基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキルースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、(フルオロメチル)スルファニル、(クロロメチル)スルファニル、(ブロモメチル)スルファニル、(ヨードメチル)スルファニル、(ジフルオロメチル)スルファニル、(トリフルオロメチル)スルファニル、(トリクロロメチル)スルファニル、(2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルファニル、(ペンタフルオロエチル)スルファニル、(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)スルファニル、(ヘプタフルオロプロピル)

スルファニル、(ヘプタフルオロイソプロピル) スルファニル、(ノナフルオロブチル) スルファニル、(パーフルオロヘキシル) スルファニル等の1乃至13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキル-スルファニル基が挙げられる。

「ヘテロ環-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環-スルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-スルファニル基、縮合多環式ヘテロアリール-スルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基等が挙げられる。

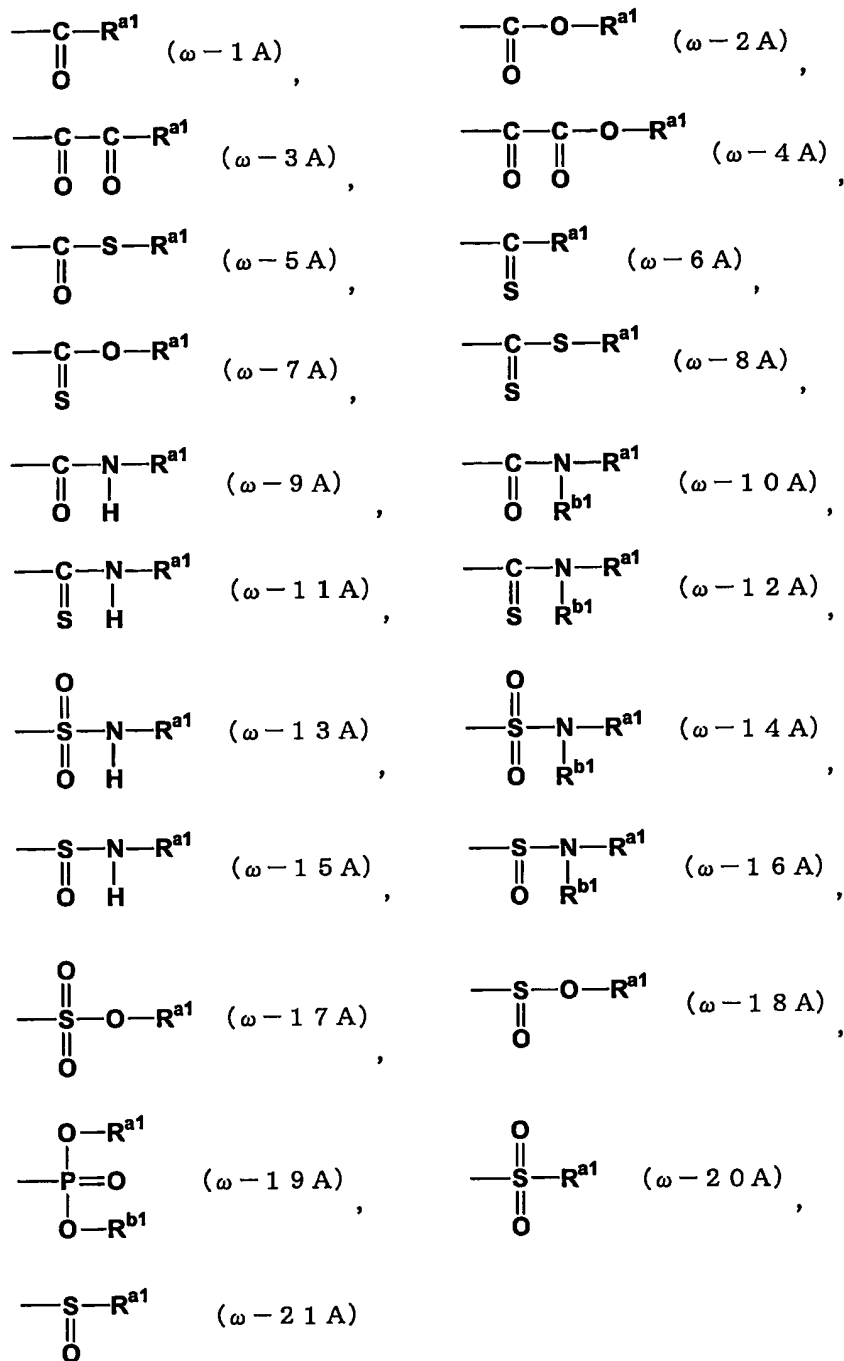
「単環式ヘテロアリール-スルファニル基」としては、例えば、(イミダゾール-2-イル) スルファニル、(1, 2, 4-トリアゾール-2-イル) スルファニル、(ピリジン-2-イル) スルファニル、(ピリジン-4-イル) スルファニル、(ピリミジン-2-イル) スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリール-スルファニル基」としては、(ベンズイミダゾール-2-イル) スルファニル、(キノリン-2-イル) スルファニル、(キノリン-4-イル) スルファニル等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基」としては、例えば、(3-ピロリジニル) スルファニル、(4-ピペリジニル) スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基」としては、例えば、(3-インドリニル) スルファニル、(4-クロマニル) スルファニル等の基が挙げられる。

「アシル基」としては、例えば、ホルミル基、グリオキシロイル基、チオホルミル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、スルファモイル基、スルフィナモイル基、カルボキシ基、スルホ基、ホスホノ基、及び下記式：



(式中、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ は、同一又は異なって、炭化水素基又はヘテロ環基を表すか、あるいは $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシル基」の定義において、

式 (ω-1 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル基」(具体例: アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ラウロイル、ミリストイル、パルミトイル、アクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイル、クロトノイル、イソクロトノイル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘキシルメチルカルボニル、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル、フェニルアセチル等の基)、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル基」(具体例: 2-テノイル、3-フロイル、ニコチノイル、イソニコチノイル等の基) と称する。

式 (ω-2 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル基」(具体例: メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、フェノキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル等の基)、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル基」(具体例: 3-ピリジルオキシカルボニル等の基) と称する。

式 (ω-3 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-カルボニル基」(具体例: ピルボイル等の基)、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-カルボニル基」 と称する。

式 (ω-4 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル-カルボニル基」(具体例: メトキサリル、エトキサリル等の基)、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル-カルボニル基」 と称する。

式 (ω-5 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-カルボニル基」、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-カルボニル基」 と称する。

式 (ω-6 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-チオカルボニル基」、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-チオカルボニル基」 と称する。

式 (ω-7 A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-



オキシチオカルボニル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシチオカルボニル基」と称する。

式(ω-8A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニルチオカルボニル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニルチオカルボニル基」と称する。

式(ω-9A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-カルバモイル基」(具体例：N-メチルカルバモイル等の基)、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモイル基」と称する。

式(ω-10A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル基」(具体例：N, N-ジメチルカルバモイル等の基)、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル基」、 $R^{a1}$ が炭化水素基であり $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-置換カルバモイル基」、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-カルボニル基」(具体例：モルホリノカルボニル等の基)と称する。

式(ω-11A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル基」と称する。

式(ω-12A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル基」、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル基」、 $R^{a1}$ が炭化水素基であり $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル基」、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-チオカルボニル基」と称する。

式(ω-13A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル基」と称する。

式(ω-14A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>が炭化水素基である基を「N，N-ジ（炭化水素）-スルファモイル基」（具体例：N，N-ジメチルスルファモイル等の基）、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>がヘテロ環基である基を「N，N-ジ（ヘテロ環）スルファモイル基」、R<sup>a1</sup>が炭化水素基でありR<sup>b1</sup>がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル基」、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルホニル基」（具体例：1-ピロリルスルホニル等の基）と称する。

式(ω-15A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル基」、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル基」と称する。

式(ω-16A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>が炭化水素基である基を「N，N-ジ（炭化水素）-スルフィナモイル基」、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>がヘテロ環基である基を「N，N-ジ（ヘテロ環）-スルフィナモイル基」、R<sup>a1</sup>が炭化水素基でありR<sup>b1</sup>がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル基」、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルフィニル基」と称する。

式(ω-17A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル基」、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル基」と称する。

式(ω-18A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル基」、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル基」と称する。

式(ω-19A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>が炭化水素基である基を「O，O'-ジ（炭化水素）-ホスホノ基」、R<sup>a1</sup>及びR<sup>b1</sup>がヘテロ環基である基を「O，O'-ジ（ヘテロ環）-ホスホノ基」、R<sup>a1</sup>が炭化水素基でありR<sup>b1</sup>がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ基」と称する。

式(ω-20A)で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素

ースルホニル基」(具体例:メタンスルホニル、ベンゼンスルホニル等の基)、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルホニル基」と称する。

式( $\omega-21A$ )で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ースルフィニル基」具体例:メチルスルフィニル、ベンゼンスルフィニル等の基)、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルフィニル基」と称する。

上記式( $\omega-1A$ )乃至( $\omega-21A$ )で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1A$ )で表される「炭化水素ーカルボニル基」としては、アルキルーカルボニル基、アルケニルーカルボニル基、アルキニルーカルボニル基、シクロアルキルーカルボニル基、シクロアルケニルーカルボニル基、シクロアルカンジエニルーカルボニル基、シクロアルキルーアルキルーカルボニル基等の脂肪族炭化水素ーカルボニル基;アリールーカルボニル基;アラルキルーカルボニル基;架橋環式炭化水素ーカルボニル基;スピロ環式炭化水素ーカルボニル基;テルペン系炭化水素ーカルボニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2A$ )乃至( $\omega-21A$ )で表される基も同様である。

上記式( $\omega-1A$ )乃至( $\omega-21A$ )で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1A$ )で表される「ヘテロ環ーカルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2A$ )乃至( $\omega-21A$ )で表される基も同様である。

上記式( $\omega-10A$ )乃至( $\omega-16A$ )で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

本明細書において、ある官能基について「置換基を有していてもよい」という場合には、特に言及する場合を除き、その官能基が、化学的に可能な位置に1個又は2個以上の「置換基」を有する場合があることを意味する。官能基に存在する置換基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換

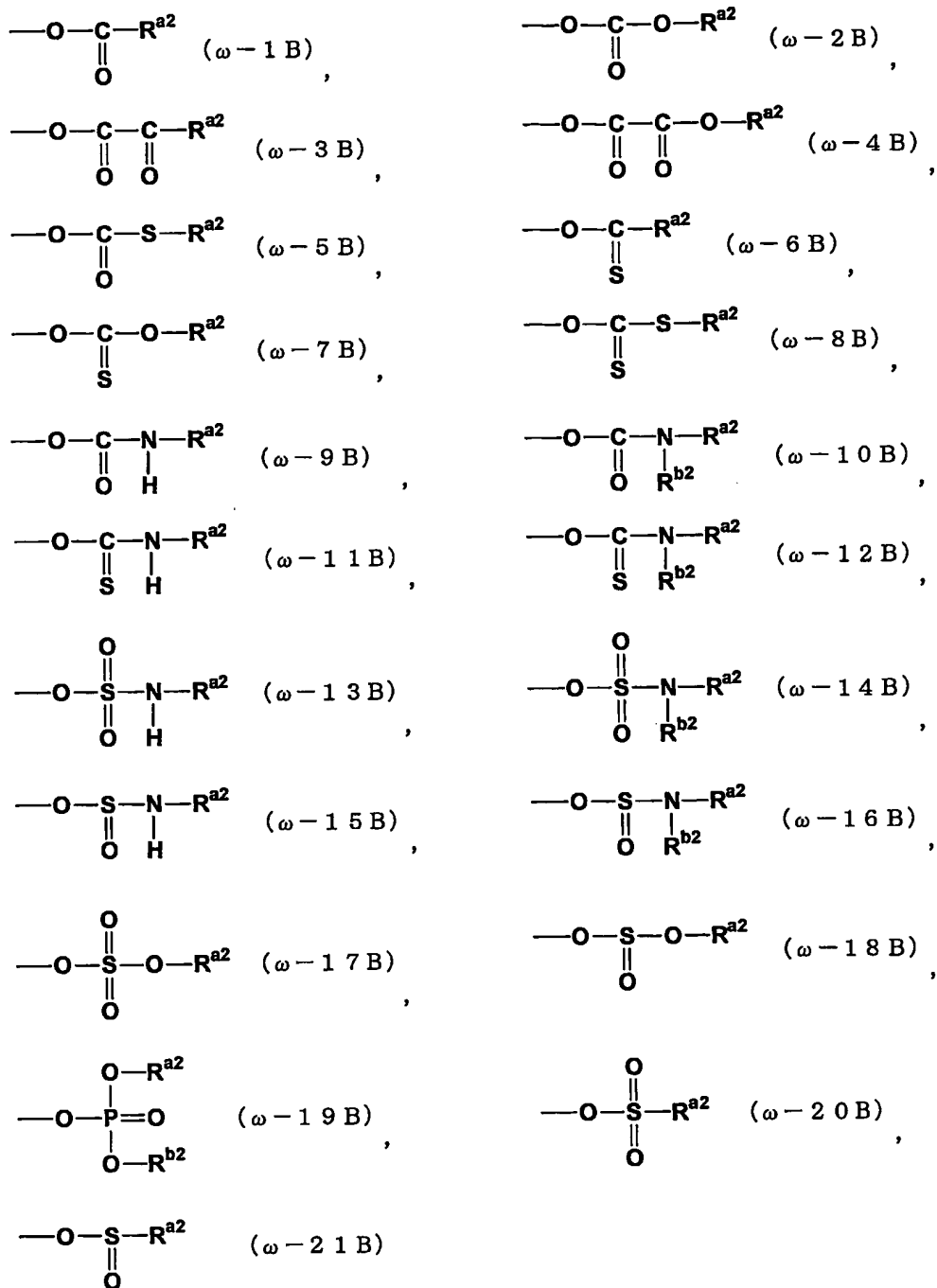
基が存在する場合には、それらは同一であっても異なってもよい。官能基に存在する「置換基」としては、例えば、ハロゲン原子、オキシ基、チオキシ基、ニトロ基、ニトロソ基、シアノ基、イソシアノ基、シアナト基、チオシアナト基、イソシアナト基、イソチオシアナト基、ヒドロキシ基、スルファニル基、カルボキシ基、スルファニルカルボニル基、オキサロ基、メソオキサロ基、チオカルボキシ基、ジチオカルボキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、スルホ基、スルファモイル基、スルフィノ基、スルフィナモイル基、スルフェノ基、スルフェナモイル基、ホスホノ基、ヒドロキシホスホニル基、炭化水素基、ヘテロ環基、炭化水素-オキシ基、ヘテロ環-オキシ基、炭化水素-スルファニル基、ヘテロ環-スルファニル基、アシル基、アミノ基、ヒドラジノ基、ヒドラゾノ基、ジアゼニル基、ウレイド基、チオウレイド基、グアニジノ基、カルバモイミドイル基（アミジノ基）、アジド基、イミノ基、ヒドロキシアミノ基、ヒドロキシイミノ基、アミノオキシ基、ジアゾ基、セミカルバジノ基、セミカルバゾノ基、アロファニル基、ヒダントイル基、ホスファノ基、ホスホロソ基、ホスホ基、ボリル基、シリル基、スタニル基、セラニル基、オキシド基等を挙げることができる。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」が2個以上存在する場合、該2個以上の置換基は、それらが結合している原子と一緒になって環式基を形成してもよい。このような環式基には、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種が1個以上含有されていてもよく、該環上には1個以上の置換基が存在していてもよい。該環は、単環式又は縮合多環式のいずれであってもよく、芳香族又は非芳香族のいずれであってもよい。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」は、該置換基上の化学的に可能な位置で、上記「置換基」によって置換されていてもよい。置換基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換基で置換される場合には、それらは同一であっても異なってもよい。そのような例として、例えば、ハロゲン化アルキル-カルボニル基（具体例：トリフルオロア

セチル等の基)、ハロゲン化アルキルースルホニル基(具体例:トリフルオロメタン  
スルホニル等の基)、アシルーオキシ基、アシルースルファニル基、N-炭化水  
素基-アミノ基、N, N-ジ(炭化水素)-アミノ基、N-ヘテロ環-アミノ基、  
N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基、アシルーアミノ基、ジ(アシル)-ア  
ミノ基等の基が挙げられる。また、上記「置換基」上での「置換」は複数次にわ  
たって繰り返されてもよい。

「アシルーオキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「アシル基」で置  
換された基が挙げられ、例えば、ホルミルオキシ基、グリオキシロイルオキシ基、  
チオホルミルオキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、ス  
ルファモイルオキシ基、スルフィナモイルオキシ基、カルボキシオキシ基、スル  
ホオキシ基、ホスホノオキシ基、及び下記式:



(式中、 $R^{a2}$  及び  $R^{b2}$  は、同一又は異なって、炭化水素基、又はヘテロ環基を表すか、あるいは  $R^{a2}$  及び  $R^{b2}$  が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシルーオキシ基」の定義において、

式 ( $\omega-1B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-オキシ基」(具体例: アセトキシ、ベンゾイルオキシ等の基)、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-2B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-カルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-カルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-3B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-カルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-カルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-4B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-カルボニル-カルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-カルボニル-カルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-5B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-カルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-カルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-6B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-チオカルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-チオカルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-7B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-チオカルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-チオカルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-8B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-チオカルボニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-チオカルボニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-9B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-カルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモイル-オキシ基」と称する。

式( $\omega-10B$ )で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-カルボニル-オキシ基」と称する。

式( $\omega-11B$ )で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」と称する。

式( $\omega-12B$ )で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-チオカルボニル-オキシ基」と称する。

式( $\omega-13B$ )で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル-オキシ基」と称する。

式( $\omega-14B$ )で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルファモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルホニル-オキシ基」と称する。



式 ( $\omega-15B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-16B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルフィニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-17B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-18B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-19B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノ-オキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノ-オキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「O-炭化水素置換-O'-ヘテロ環置換ホスホノ-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-20B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニル-オキシ基」と称する。

式 ( $\omega-21B$ ) で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニル-オキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニル-オキシ基」と称する。

上記式 ( $\omega-1B$ ) 乃至 ( $\omega-21B$ ) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1B$ ) で表される「炭化水素-カルボニル-オキシ基」としては、アルキル-カルボニル-オキシ基、アルケニル-カルボニル-オキシ基、アルキニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルキル-カルボニル-オキシ基、シクロアルケニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルカンジエニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルキル-アルキル-カルボニル-オキシ基等の脂肪族炭化水素-カルボニル-オキシ基；アリール-カルボニル-オキシ基；アラルキル-カルボニル-オキシ基；架橋環式炭化水素-カルボニル-オキシ基；スピロ環式炭化水素-カルボニル-オキシ基；テルペン系炭化水素-カルボニル-オキシ基が挙げられる。以下、式 ( $\omega-2B$ ) 乃至 ( $\omega-21B$ ) で表される基も同様である。

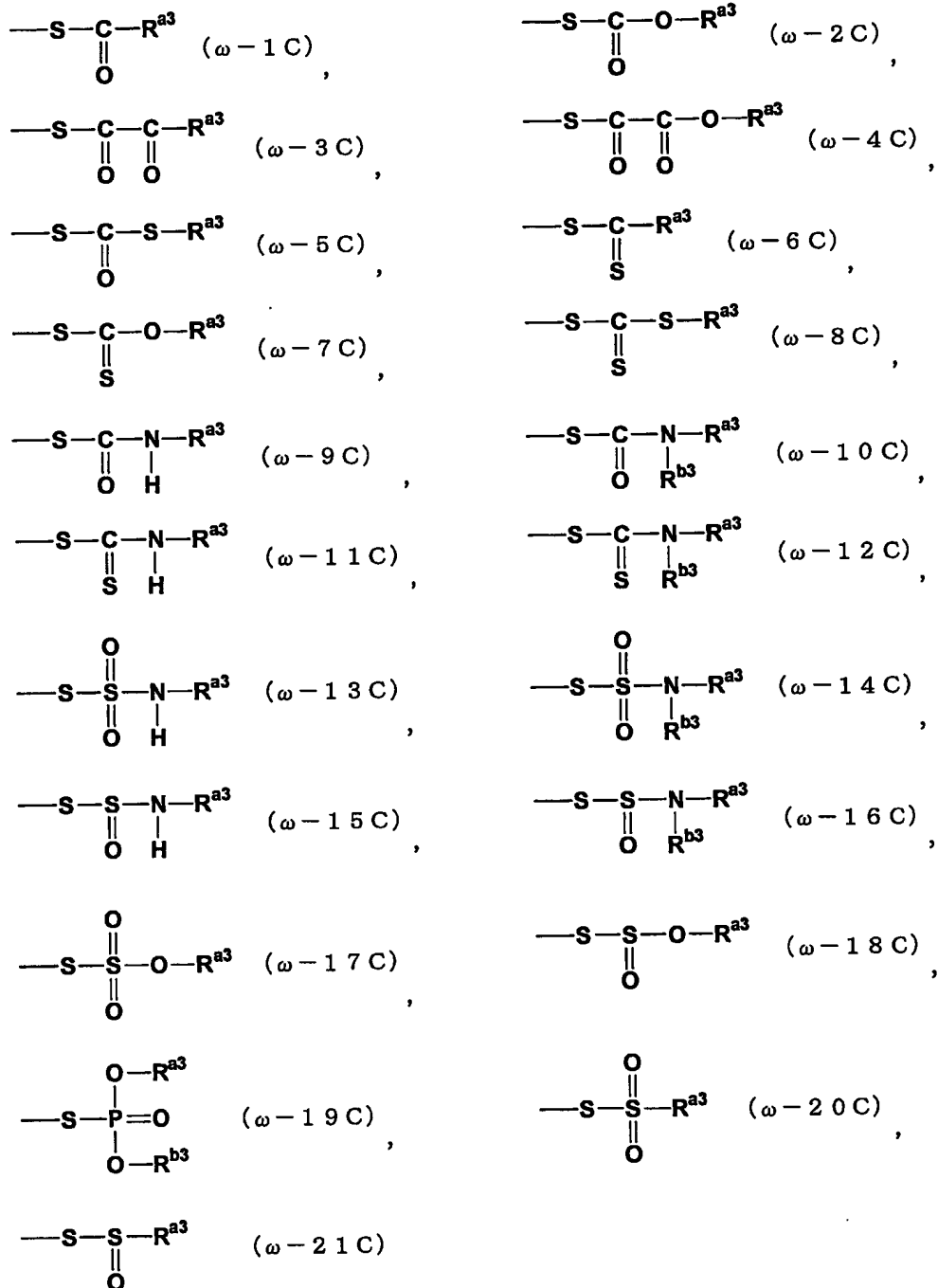
上記式 ( $\omega-1B$ ) 乃至 ( $\omega-21B$ ) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1B$ ) で表される「ヘテロ環-カルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-カルボニル基、縮合多環式ヘテロアリール-カルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル基が挙げられる。以下、式 ( $\omega-2B$ ) 乃至 ( $\omega-21B$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-10B$ ) 乃至 ( $\omega-16B$ ) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシル-オキシ基」、「炭化水素-オキシ基」、及び「ヘテロ環-オキシ基」を総称して、「置換オキシ基」と称する。また、これら「置換オキシ基」と「ヒドロキシ基」を総称して、「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と称する。

「アシル-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルスルファニル基、グリオキシロイルスルファニル基、チオホルミルスルファニル基、カルバモイルスルファニル基、チオカルバモイルスルファニル基、スルファモイルスルファニル基、スルフィナモイルスルファニル基、カルボキシスルファニル基、スルホスルファニル

基、ホスホノスルファニル基、及び下記式：



(式中、 $\text{R}^{a3}$ 及び $\text{R}^{b3}$ は、同一又は異なって、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、あるいは $\text{R}^{a3}$ 及び $\text{R}^{b3}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有して

もよい環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」の定義において、

式 ( $\omega-1$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-2$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-3$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-カルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-カルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-4$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル-カルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル-カルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-5$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-カルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-カルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-6$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-チオカルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-チオカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-7$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシチオカルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-8$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-チオカルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-チオカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-9$  C) で表される基の中で、 $R^{a3}$  が炭化水素基である基を「N-炭化水

素－カルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「N－ヘテロ環－カルバモイル－スルファニル基」と称する。

式( $\omega-10C$ )で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「N, N－ジ(炭化水素)－カルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N, N－ジ(ヘテロ環)－カルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N－炭化水素－N－ヘテロ環－カルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ－カルボニル－スルファモイル基」と称する。

式( $\omega-11C$ )で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「N－炭化水素－チオカルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「N－ヘテロ環－チオカルバモイル－スルファニル基」と称する。

式( $\omega-12C$ )で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「N, N－ジ(炭化水素)－チオカルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N, N－ジ(ヘテロ環)－チオカルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N－炭化水素－N－ヘテロ環－チオカルバモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ－チオカルボニル－スルファニル基」と称する。

式( $\omega-13C$ )で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「N－炭化水素－スルファモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「N－ヘテロ環－スルファモイル－スルファニル基」と称する。

式( $\omega-14C$ )で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「N, N－ジ(炭化水素)－スルファモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N, N－ジ(ヘテロ環)－スルファモイル－スルフィニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N－炭化水素－N－ヘテロ環スルファモイル－スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が一緒になって、それら

が結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルホニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-15C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-16C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルファニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-17C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシースルホニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシースルホニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-18C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシースルフィニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシースルフィニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-19C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノースルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノースルファニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-20C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニルースルファニル基」と称する。

式 ( $\omega-21C$ ) で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素

ースルフィニルースルファニル基」、 $R^{*3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ー  
スルフィニルースルファニル基」と称する。

上記式 ( $\omega-1C$ ) 乃至 ( $\omega-21C$ ) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1C$ ) で表される「炭化水素ーカルボニルースルファニル基」としては、アルキルーカルボニルースルファニル基、アルケニルーカルボニルースルファニル基、アルキニルーカルボニルースルファニル基、シクロアルキルーカルボニルースルファニル基、シクロアルケニルーカルボニルースルファニル基、シクロアルカンジエニルーカルボニルースルファニル基、シクロアルキルーアルキルーカルボニルースルファニル基等の脂肪族炭化水素ーカルボニルースルファニル基；アリールーカルボニルースルファニル基；アラルキルーカルボニルースルファニル基；架橋環式炭化水素ーカルボニルースルファニル基；スピロ環式炭化水素ーカルボニルースルファニル基；テルペン系炭化水素ーカルボニルースルファニル基が挙げられる。

以下、式 ( $\omega-2C$ ) 乃至 ( $\omega-21C$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-1C$ ) 乃至 ( $\omega-21C$ ) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1C$ ) で表される「ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニルースルファニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニルースルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基が挙げられる。

以下、式 ( $\omega-2C$ ) 乃至 ( $\omega-21C$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-10C$ ) 乃至 ( $\omega-16C$ ) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」、「炭化水素ースルファニル基」、及び「ヘテロ環ースルファニル基」を総称して、「置換スルファニル基」と称する。また、これら「置換スルファニル基」と「スルファニル基」を総称して、「置換基を有しているもよいスルファニル基」と称する。

「N-炭化水素-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、N-アルキル-アミノ基、N-アルケニル-アミノ基、N-アルキニル-アミノ基、N-シクロアルキル-アミノ基、N-シクロアルキル-アルキル-アミノ基、N-アリール-アミノ基、N-アラルキル-アミノ基等が挙げられる。

「N-アルキル-アミノ基」としては、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、n-ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、(2-メチルブチル)アミノ、(1-メチルブチル)アミノ、ネオペンチルアミノ、(1, 2-ジメチルプロピル)アミノ、(1-エチルプロピル)アミノ、n-ヘキシルアミノ、(4-メチルペンチル)アミノ、(3-メチルペンチル)アミノ、(2-メチルペンチル)アミノ、(1-メチルペンチル)アミノ、(3, 3-ジメチルブチル)アミノ、(2, 2-ジメチルブチル)アミノ、(1, 1-ジメチルブチル)アミノ、(1, 2-ジメチルブチル)アミノ、(1, 3-ジメチルブチル)アミノ、(2, 3-ジメチルブチル)アミノ、(2-エチルブチル)アミノ、(1-エチルブチル)アミノ、(1-エチル-1-メチルプロピル)アミノ、n-ヘプチルアミノ、n-オクチルアミノ、n-ノニルアミノ、n-デシルアミノ、n-ウンデシルアミノ、n-ドデシルアミノ、n-トリデシルアミノ、n-テトラデシルアミノ、n-ペンタデシルアミノ等のC<sub>1</sub>~C<sub>15</sub>の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-アルケニル-アミノ基」としては、例えば、ビニルアミノ、(プロパー-1-エン-1-イル)アミノ、アリルアミノ、イソプロペニルアミノ、(ブター-1-エン-1-イル)アミノ、(ブター-2-エン-1-イル)アミノ、(ブター-3-エン-1-イル)アミノ、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル)アミノ、(1-メチルプロパー-2-エン-1-イル)アミノ、(ペンター-1-エン-1-イル)アミノ、(ペンター-2-エン-1-イル)アミノ、(ペンター-3-エン-1-イル)アミノ、(ペンター-4-エン-1-イル)アミノ、(3-メチルブター-2-エン-



1-イル) アミノ、(3-メチルブター3-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-1-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-2-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-3-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-4-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-5-エン-1-イル) アミノ、(4-メチルペンター3-エン-1-イル) アミノ、(4-メチルペンター3-エン-1-イル) アミノ、(ヘプター1-エン-1-イル) アミノ、(ヘプター6-エン-1-イル) アミノ、(オクター1-エン-1-イル) アミノ、(オクター7-エン-1-イル) アミノ、(ノナ-1-エン-1-イル) アミノ、(ノナ-8-エン-1-イル) アミノ、(デカ-1-エン-1-イル) アミノ、(デカ-9-エン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-10-エン-1-イル) アミノ、(ドデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(ドデカ-11-エン-1-イル) アミノ、(トリデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(トリデカ-12-エン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-13-エン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-14-エン-1-イル) アミノ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルケニル-アミノ基が挙げられる。

「N-アルケニル-アミノ基」としては、例えば、エチニルアミノ、(プロパー1-イン-1-イル) アミノ、(プロパー2-イン-1-イル) アミノ、(ブター1-イン-1-イル) アミノ、(ブター3-イン-1-イル) アミノ、(1-メチルプロパー2-イン-1-イル) アミノ、(ペンター1-イン-1-イル) アミノ、(ペンター4-イン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-1-イン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-5-イン-1-イル) アミノ、(ヘプター1-イン-1-イル、(ヘプター6-イン-1-イル) アミノ、(オクター1-イン-1-イル) アミノ、(オクター7-イン-1-イル) アミノ、(ノナ-1-イン-1-イル) アミノ、(ノナ-8-イン-1-イル) アミノ、(デカ-1-イン-1-イル) アミノ、(デカ-9-イン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-10-イン-1-イル) アミノ、(ドデカ-1-イン-1-イル) アミノ、

(ドデカ-11-イン-1-イル) アミノ、(トリデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(トリデカ-12-イン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-13-イン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) アミノ等の  $C_2 \sim C_{15}$  の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキル-アミノ基」としては、例えば、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、シクロヘプチルアミノ、シクロオクチルアミノ等の  $C_3 \sim C_8$  のN-シクロアルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキル-アルキル-アミノ基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) アミノ、(1-シクロプロピルエチル) アミノ、(2-シクロプロピルエチル) アミノ、(3-シクロプロピルプロピル) アミノ、(4-シクロプロピルブチル) アミノ、(5-シクロプロピルペンチル) アミノ、(6-シクロプロピルヘキシル) アミノ、(シクロブチルメチル) アミノ、(シクロペンチルメチル) アミノ、(シクロブチルメチル) アミノ、(シクロペンチルメチル) アミノ、(シクロヘキシルメチル) アミノ、(2-シクロヘキシルエチル) アミノ、(3-シクロヘキシルプロピル) アミノ、(4-シクロヘキシルブチル) アミノ、(シクロヘプチルメチル) アミノ、(シクロオクチルメチル) アミノ、(6-シクロオクチルヘキシル) アミノ等の  $C_4 \sim C_{14}$  のN-シクロアルキル-アルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-アリール-アミノ基」としては、例えば、フェニルアミノ、1-ナフチルアミノ、2-ナフチルアミノ、アントリルアミノ、フェナントリルアミノ、アセナフチレニルアミノ等の  $C_6 \sim C_{14}$  のN-モノ-アリールアミノ基が挙げられる。

「N-アラルキル-アミノ基」としては、例えば、ベンジルアミノ、(1-ナフチルメチル) アミノ、(2-ナフチルメチル) アミノ、(アントラセニルメチル) アミノ、(フェナントレニルメチル) アミノ、(アセナフチレニルメチル) アミノ、(ジフェニルメチル) アミノ、(1-フェネチル) アミノ、(2-フェネチル) ア

ミノ、(1-(1-ナフチル)エチル)アミノ、(1-(2-ナフチル)エチル)アミノ、(2-(1-ナフチル)エチル)アミノ、(2-(2-ナフチル)エチル)アミノ、(3-フェニルプロピル)アミノ、(3-(1-ナフチル)プロピル)アミノ、(3-(2-ナフチル)プロピル)アミノ、(4-フェニルブチル)アミノ、(4-(1-ナフチル)ブチル)アミノ、(4-(2-ナフチル)ブチル)アミノ、(5-フェニルペンチル)アミノ、(5-(1-ナフチル)ペンチル)アミノ、(5-(2-ナフチル)ペンチル)アミノ、(6-フェニルヘキシル)アミノ、(6-(1-ナフチル)ヘキシル)アミノ、(6-(2-ナフチル)ヘキシル)アミノ等のC<sub>7</sub>~C<sub>16</sub>のN-アラルキル-アミノ基が挙げられる。

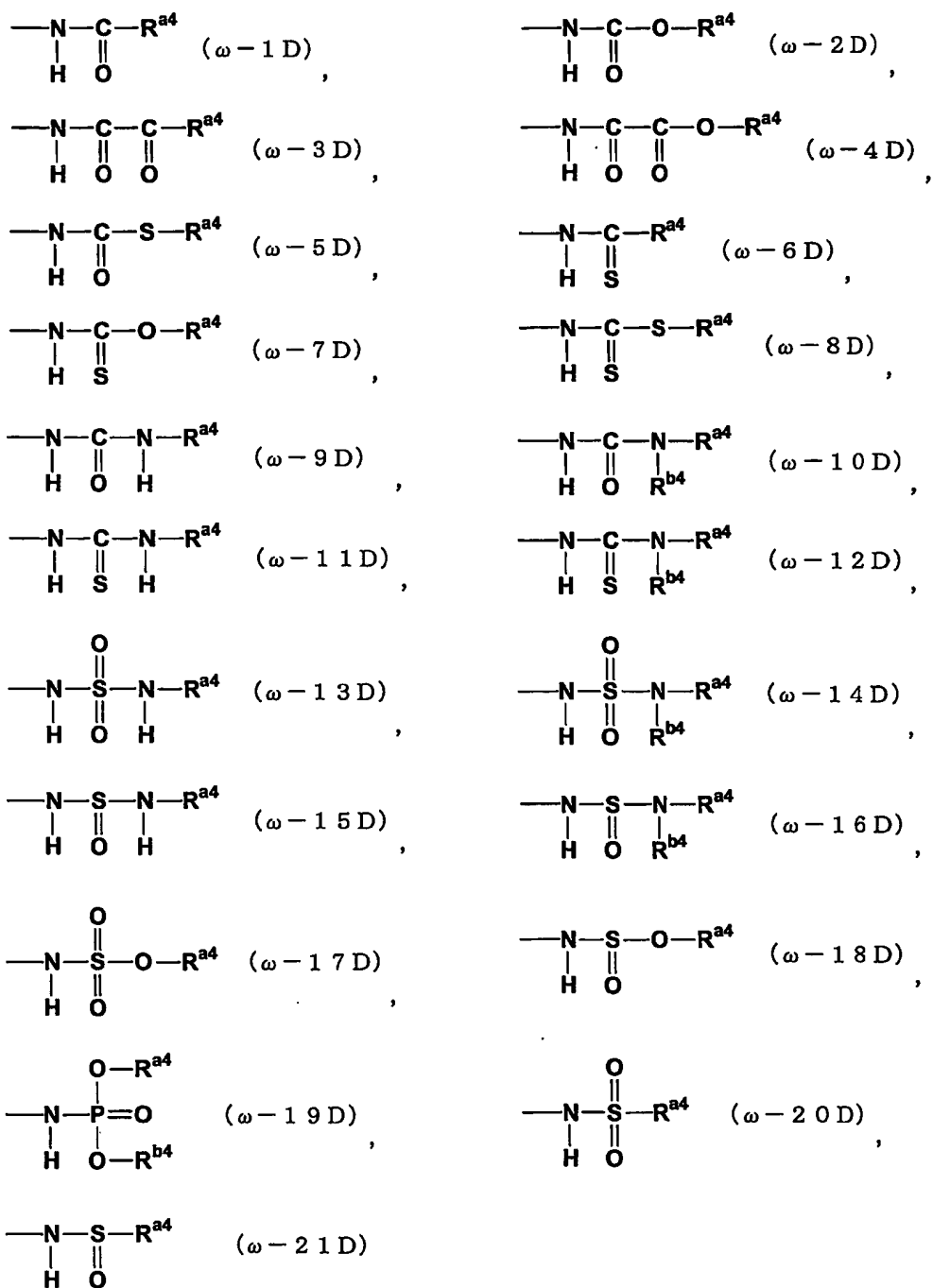
「N, N-ジ(炭化水素)-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、N, N-ジ-n-プロピルアミノ、N, N-ジイソプロピルアミノ、N-アリル-N-メチルアミノ、N-(プロパー-2-イン-1-イル)-N-メチルアミノ、N, N-ジシクロヘキシルアミノ、N-シクロヘキシル-N-メチルアミノ、N-シクロヘキシルメチルアミノ-N-メチルアミノ、N, N-ジフェニルアミノ、N-メチル-N-フェニルアミノ、N, N-ジベンジルアミノ、N-ベンジル-N-メチルアミノ等の基が挙げられる。

「N-ヘテロ環-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つ水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、例えば、(3-ピロリジニル)アミノ、(4-ピペリジニル)アミノ、(2-テトラヒドロピラニル)アミノ、(3-インドリニル)アミノ、(4-クロマニル)アミノ、(3-チエニル)アミノ、(3-ピリジニル)アミノ、(3-キノリル)アミノ、(5-インドリル)アミノ等の基が挙げられる。

「N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」及び「ヘテロ環基」で1つずつ置換された基が挙げられ、例えば、N-メチル-N-(4-ピペリジニル)アミノ、N-(4-クロマニル)-N-メチルアミノ、N-メチル-N-(3-チエニル)アミノ、N-メチル-

N-(3-ピリジル)アミノ、N-メチル-N-(3-キノリル)アミノ等の基が挙げられる。

「アシルアミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルアミノ基、グリオキシロイルアミノ基、チオホルミルアミノ基、カルバモイルアミノ基、チオカルバモイルアミノ基、スルファモイルアミノ基、スルフィナモイルアミノ基、カルボキシアミノ基、スルホアミノ基、ホスホアミノ基、及び下記式：



(式中、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ は、同一又は異なって、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、あるいは $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシルーアミノ基」の定義において、

式 ( $\omega-1D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-2D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-3D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-4D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-5D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-6D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-7D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-8D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーチオカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-9D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ーカルバモイル基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「Nーヘテロ環ーカルバモ

イルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-10D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-カルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-11D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-12D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-チオカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-13D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-14D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「ジ(炭化水素)スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルホニルーアミノ基」と称する。

式 ( $\omega-15D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-アミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-アミノ基」と称する。; 式 ( $\omega-16D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイル-アミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル-アミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-アミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルフィニル-アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-17D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-アミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-18D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-アミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-19D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノ-アミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノ-アミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ-アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-20D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル-アミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニル-アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-21D$ ) で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニル-アミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニル-アミノ基」と称する。

上記式 ( $\omega-1D$ ) 乃至 ( $\omega-21D$ ) で表される基における「炭化水素」とし

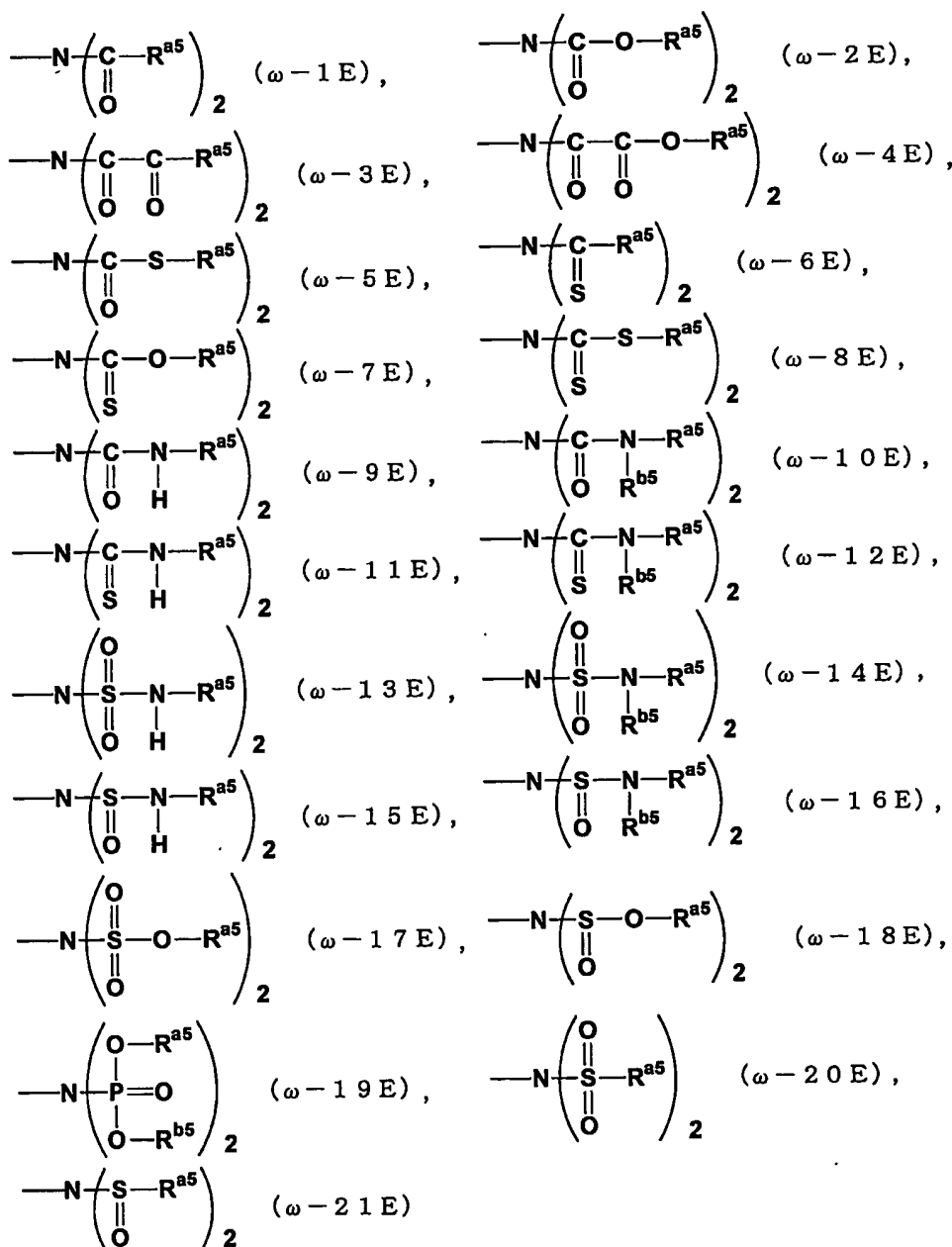


ては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1D$ ) で表される「炭化水素-カルボニル-アミノ基」としては、アルキル-カルボニル-アミノ基、アルケニル-カルボニル-アミノ基、アルキニル-カルボニル-アミノ基、シクロアルキル-カルボニル-アミノ基、シクロアルケニル-カルボニル-アミノ基、シクロアルカンジエニル-カルボニル-アミノ基、シクロアルキル-アルキル-カルボニル-アミノ基等の脂肪族炭化水素-カルボニル-アミノ基；アリール-カルボニル-アミノ基；アラルキル-カルボニル-アミノ基；架橋環式炭化水素-カルボニル-アミノ基；スピロ環式炭化水素-カルボニル-アミノ基；テルペン系炭化水素-カルボニル-アミノ基が挙げられる。以下、式 ( $\omega-2D$ ) 乃至 ( $\omega-21D$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-1D$ ) 乃至 ( $\omega-21D$ ) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1D$ ) で表される「ヘテロ環-カルボニル-アミノ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-カルボニル-アミノ基、縮合多環式ヘテロアリール-カルボニル-アミノ基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル-アミノ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル-アミノ基が挙げられる。以下、式 ( $\omega-2D$ ) 乃至 ( $\omega-21D$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-10D$ ) 乃至 ( $\omega-16D$ ) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

「ジ(アシル)-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、上記「置換基を有していてもよい」の「置換基」の定義における「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ジ(ホルミル)-アミノ基、ジ(グリオキシロイル)-アミノ基、ジ(チオホルミル)-アミノ基、ジ(カルバモイル)-アミノ基、ジ(チオカルバモイル)-アミノ基、ジ(スルファモイル)-アミノ基、ジ(スルフィナモイル)-アミノ基、ジ(カルボキシ)-アミノ基、ジ(スルホ)-アミノ基、ジ(ホスホノ)-アミノ基、及び下記式：



(式中、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ は、同一又は異なって、水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、あるいは $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す)で表される基があげられる

上記「ジ(アシル)ーアミノ基」の定義において、

式( $\omega-1\text{E}$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素

ーカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-2E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーオキシーカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーオキシーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-3E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-4E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-5E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ースルファニルーカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ースルファニルーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-6E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーチオカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-7E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーオキシーチオカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーオキシーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-8E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ースルファニルーチオカルボニル)ーアミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-9E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(Nー炭化水素ーカルバモイル)アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(Nーヘテロ環ーカルバモイル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-10E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス

〔N, N-ジ（炭化水素）-カルバモイル〕-アミノ基〕、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス〔N, N-ジ（ヘテロ環）-カルバモイル〕-アミノ基〕、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス（N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル）-アミノ基〕、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス（環状アミノ-カルボニル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-11E$ ）で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス（N-炭化水素-チオカルバモイル）-アミノ基〕、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス（N-ヘテロ環-チオカルバモイル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-12E$ ）で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス〔N, N-ジ（炭化水素）-チオカルバモイル〕-アミノ基〕、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス〔N, N-ジ（ヘテロ環）-チオカルバモイル〕-アミノ基〕、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス（N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル）-アミノ基〕、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス（環状アミノ-チオカルボニル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-13E$ ）で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス（N-炭化水素-スルファモイル）-アミノ基〕、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス（N-ヘテロ環-スルファモイル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-14E$ ）で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス〔N, N-ジ（炭化水素）-スルファモイル〕-アミノ基〕、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス〔N, N-ジ（ヘテロ環）-スルファモイル〕-アミノ基〕、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス（N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル）-アミノ基〕、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス（環状アミノ-スルホニル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-15E$ ）で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス（N-炭

化水素－スルフィナモイル)－アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (N－ヘテロ環－スルフィナモイル)－アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-16E$ ) で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス [N, N－ジ (炭化水素)－スルフィナモイル]－アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス [N, N－ジ (ヘテロ環)－スルフィナモイル]－アミノ基」、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (N－炭化水素－N－ヘテロ環－スルフィナモイル)－アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス (環状アミノ－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-17E$ ) で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－オキシ－スルホニル)－アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－オキシ－スルホニル)－アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-18E$ ) で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－オキシ－スルフィニル)－アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－オキシ－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-19E$ ) で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス [O, O'－ジ (炭化水素)－ホスホノ]－アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス [O, O'－ジ (ヘテロ環)－ホスホノ]－アミノ基」、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (O－炭化水素－O'－ヘテロ環－ホスホノ)－アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-20E$ ) で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－スルホニル)－アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－スルホニル)－アミノ基」と称する。

式 ( $\omega-21E$ ) で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－スルフィニル)－アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

上記式 ( $\omega-1E$ ) 乃至 ( $\omega-21E$ ) で表される基における「炭化水素」とし

ては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1E$ ) で表される「ビス (炭化水素-カルボニル) -アミノ基」としては、ビス (アルキル-カルボニル) -アミノ基、ビス (アルケニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (アルキニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルキル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルケニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルカンジエニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルキル-アルキル-カルボニル) -アミノ基等のビス (脂肪族炭化水素-カルボニル) -アミノ基；ビス (アリール-カルボニル) -アミノ基；ビス (アラルキル-カルボニル) -アミノ基；ビス (架橋環式炭化水素-カルボニル) -アミノ基；ビス (スピロ環式炭化水素-カルボニル) -アミノ基；ビス (テルペン系炭化水素-カルボニル) -アミノ基が挙げられる。以下、式 ( $\omega-2E$ ) 乃至 ( $\omega-21E$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-1E$ ) 乃至 ( $\omega-21E$ ) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ( $\omega-1E$ ) で表される「ビス (ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基」としては、例えば、ビス (単環式ヘテロアリール-カルボニル) -アミノ基、ビス (縮合多環式ヘテロアリール-カルボニル) -アミノ基、ビス (単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基、ビス (縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基が挙げられる。以下、式 ( $\omega-2E$ ) 乃至 ( $\omega-21E$ ) で表される基も同様である。

上記式 ( $\omega-10E$ ) 乃至 ( $\omega-16E$ ) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

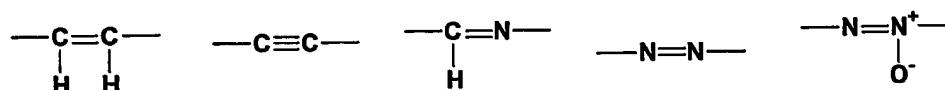
上記「アシル-アミノ基」及び「ジ (アシル) -アミノ基」を総称して、「アシル置換アミノ基」と称する。また、上記「N-炭化水素-アミノ基」、「N, N-ジ (炭化水素) -アミノ基」、「N-ヘテロ環-アミノ基」、「N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基」、「環状アミノ基」、「アシル-アミノ基」、及び「ジ (アシル) -アミノ基」を総称して、「置換アミノ基」と称する。

以下、上記一般式 (I) で表される化合物について具体的に説明する。

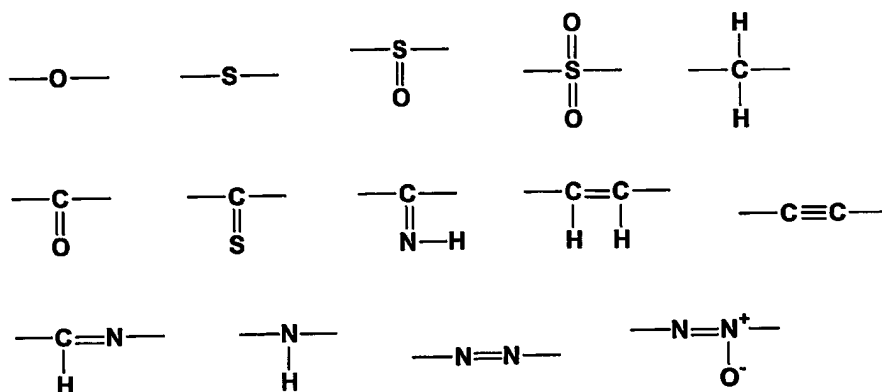
Xの定義における「主鎖の原子数が2ないし5である連結基」とは、環ZとEの間に、主鎖の原子が2ないし5個連なっている連結基を意味する。上記「主鎖の原子数」は、ヘテロ原子の有無に関わらず、環ZとEとの間に存在する原子の数が最小となるように数えるものとする。例えば、1, 2-シクロペンチレンの原子数を2個、1, 3-シクロペンチレンの原子数を3個、1, 4-フェニレンの原子数を4個、2, 6-ピリジンジイルの原子数を3個として数える。

上記「主鎖の原子数が2ないし5である連結基」は、下記2価基群 $\alpha$ -1より選択される基1個で形成されるか、或いは、下記2価基群 $\alpha$ -2より選択される基1ないし4種が2ないし4個結合して形成される。

[2価基群 $\alpha$ -1] 下記式：



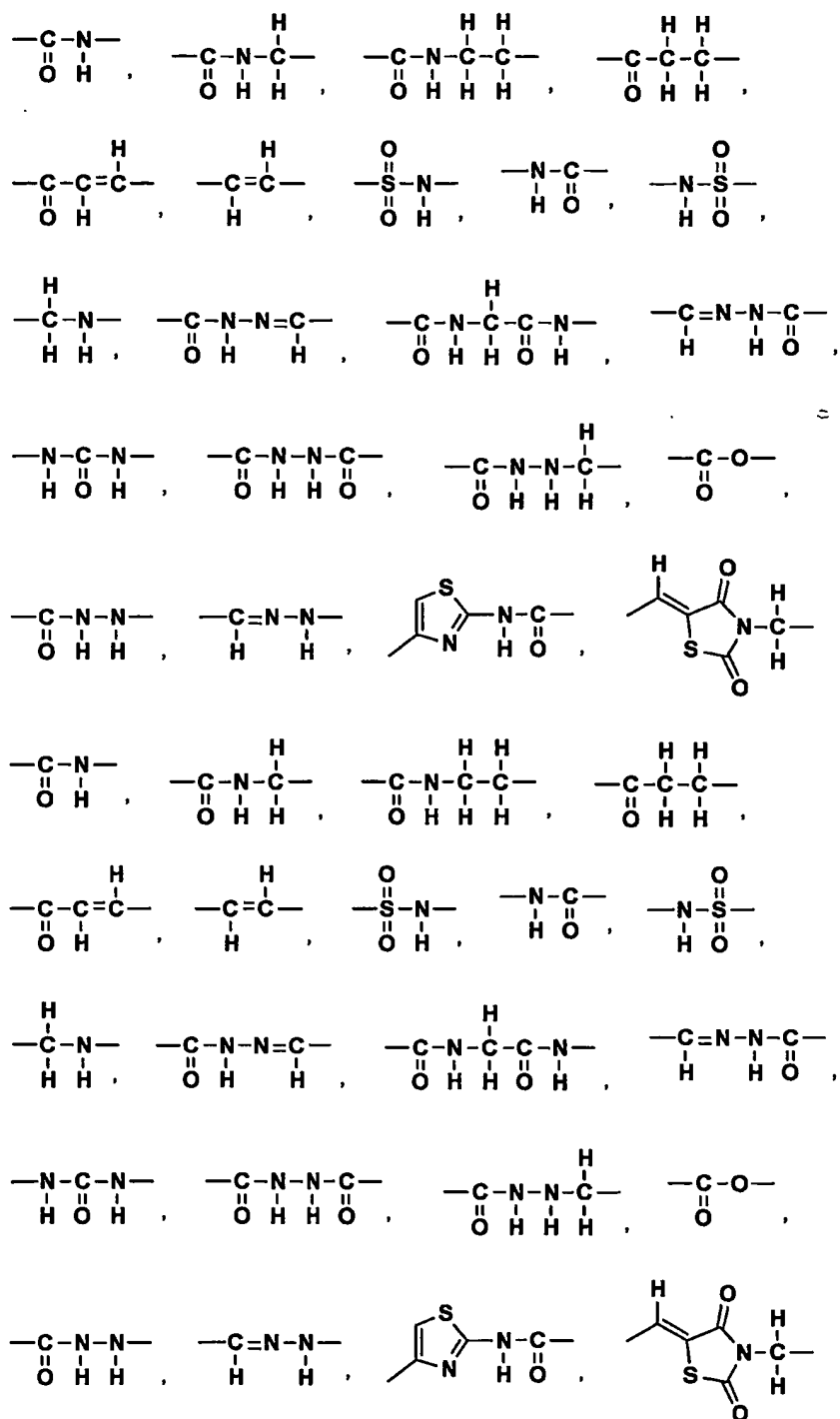
[2価基群 $\alpha$ -2] 下記式：



該2価基が2個以上結合する場合、各基は同一であっても異なってもよい。

上記「主鎖の原子数が2ないし5である連結基」としては、好適には、下記連結基群 $\alpha$ より選択される基である。

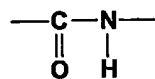
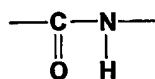
[連結基群 $\alpha$ ] 下記式：



(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)

最も好適には、下記式：

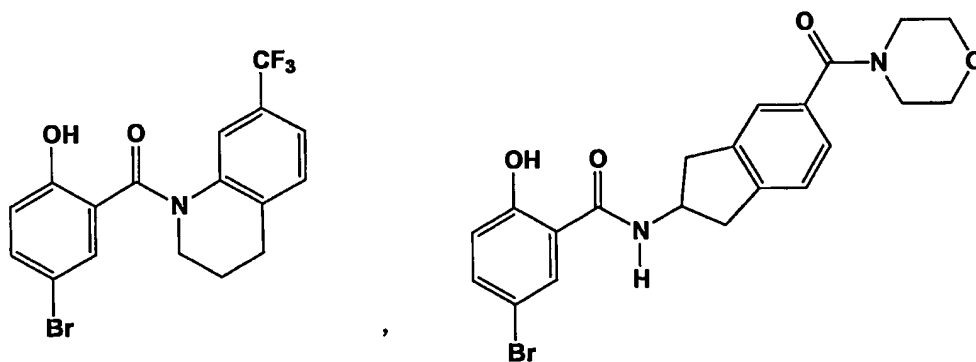




(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)

で表される基である。

「主鎖の原子数が 2 ないし 5 である連結基」の定義における「該連結基は置換基を有していてもよい」の置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられ、好適には、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基であり、さらに好適には、メチル基である。該置換基は、環 Z 又は E が有する置換基と一緒にあって、それらが結合している原子と共に、置換基を有していてもよい環式基を形成してもよい。このような例としては、一般式 (I) で表される化合物が、下記式：



である化合物が挙げられる。

上記一般式 (I) において、A としては、水素原子又はアセチル基を挙げることができ、好適には水素原子である。

環 Z の定義における「式  $\text{---O---A}$  (式中、A は上記定義と同義である) 及び式  $\text{---X---E}$  (式中、X 及び E は上記定義と同義である) で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいアレーン」の「アレーン」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素が挙げられ、例えば、ベンゼン環、ナフタレン環、アンラセ

ン環、フェナントレン環、アセナフチレン環等が挙げられる。好適には、ベンゼン環、ナフタレン環等の $C_6 \sim C_{10}$ のアレーンであり、さらに好適には、ベンゼン環及びナフタレン環であり、最も好適には、ベンゼン環である。

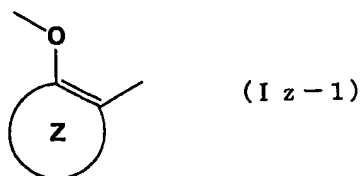
上記環Zの定義における「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいアレーン」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のアレーン上での置換位置は特に限定されない。また、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なってもよい。

上記環Zの定義における「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいアレーン」が「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいベンゼン環」である場合、好適には、「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他に更に1ないし3個の置換基を有するベンゼン環」であり、更に好適には、「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他に更に1個の置換基を有するベンゼン環」である。このとき、該置換基としては、好適には、下記「置換基群 $\gamma-1z$ 」から選択される基であり、更に好適には、ハロゲン原子及びtert-ブチル基〔(1, 1-ジメチル)エチル基〕であり、最も好適には、ハロゲン原子である。

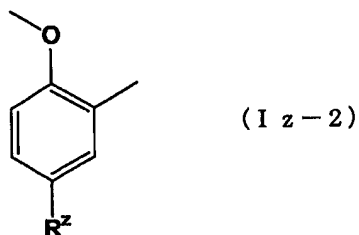
〔置換基群 $\gamma-1z$ 〕ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、メトキシ基、メチル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、1, 1, 3, 3-テトラメチルブチル基、2-フェニルエテン-1-イル基、2, 2-ジシアノエテン-1-イル基、2-シアノ-2-(メトキシカルボニル)エテン-1-イル基、2-カルボキシ-2-シアノエテン-1-イル基、エチニル基、フェニルエチニ

ル基、(トリメチルシリル) エチニル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、フェニル基、4-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2-フェネチル基、1-ヒドロキシエチル基、1-(メトキシイミノ) エチル基、1-[(ベンジルオキシ) イミノ] エチル基、2-チエニル基 [チオフェン-2-イル基]、3-チエニル基 [チオフェン-3-イル基]、1-ピロリル基 [ピロール-1-イル基]、2-メチルチアゾール-4-イル基、イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-2-イル基、2-ピリジル基 [ピリジン-2-イル基]、アセチル基、イソブチリル基、ピペリジノカルボニル基、4-ベンジルピペリジノカルボニル基、(ピロール-1-イル) スルホン基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル) フェニル] カルバモイル基、N, N-ジメチルカルバモイル基、スルファモイル基、N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル) フェニル] スルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、アミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、メタンスルホンルアミノ基、ベンゼンスルホンルアミノ基、3-フェニルウレイド基、(3-フェニル) チオウレイド基、(4-ニトロフェニル) ジアゼニル基、{[4-(ピリジン-2-イル) スルファモイル] フェニル} ジアゼニル基

上記環 Z の定義における「式-O-A (式中、A は上記定義と同義である) 及び式-X-E (式中、X 及び E は上記定義と同義である) で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいアレーン」が「式-O-A (式中、A は上記定義と同義である) 及び式-X-E (式中、X 及び E は上記定義と同義である) で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいベンゼン環」である場合、該置換基が 1 個であり、一般式 (I) における環 Z を含む下記部分構造式 (I<sub>Z-1</sub>):



が下記式 (I z - 2) :



で表される場合の  $R^z$  の位置に存在することが最も好ましい。このとき、該置換基を  $R^z$  と定義することができる。 $R^z$  としては、好適には、下記「置換基群  $\gamma - 2z$ 」から選択される基であり、更に好適には、ハロゲン原子及び *tert*-ブチル基であり、最も好適には、ハロゲン原子である。

〔置換基群  $\gamma - 2z$ 〕 ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、メトキシ基、メチル基、イソプロピル基、*tert*-ブチル基、1, 1, 3, 3-テトラメチルブチル基、2-フェニルエテン-1-イル基、2, 2-ジシアノエテン-1-イル基、2-シアノ-2-(メトキシカルボニル)エテン-1-イル基、2-カルボキシ-2-シアノエテン-1-イル基、エチニル基、フェニルエチニル基、(トリメチルシリル)エチニル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、フェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2-フェネチル基、1-ヒドロキシエチル基、1-(メトキシイミノ)エチル基、1-[(ベンジルオキシ)イミノ]エチル基、2-チエニル基、3-チエニル基、1-ピロリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-2-イル基、2-ピリジル基、アセチル基、イソブチリル基、ピペリジノカルボニル基、4-ベンジルピペリジノカルボニル基、(ピロール-1-イル)スルホニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]カルバモイル基、N, N-ジメチルカルバモイル基、スルファモイル基、N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]スルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、アミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、ベンゼンスルホニルアミノ基、3-フェ

ニルウレイド基、(3-フェニル)チオウレイド基、(4-ニトロフェニル)ジアゼニル基、{[4-(ピリジン-2-イル)スルファモイル]フェニル}ジアゼニル基

上記環Zの定義における「式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよいアレーン」が「式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよいナフタレン環」である場合、好適には、ナフタレン環である。

環Zの定義における「式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「ヘテロアレーン」としては、環系を構成する原子(環原子)として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式芳香族複素環が挙げられ、例えば、フラン環、チオフエン環、ピロール環、オキサゾール環、イソオキサゾール環、チアゾール環、イソチアゾール環、イミダゾール環、ピラゾール環、1,2,3-オキサジアゾール環、1,2,3-チアジアゾール環、1,2,3-トリアゾール環、ピリジン環、ピリダジン環、ピリミジン環、ピラジン環、1,2,3-トリアジン環、1,2,4-トリアジン環、1H-アゼピン環、1,4-オキセピン環、1,4-チアゼピン環、ベンゾフラン環、イソベンゾフラン環、ベンゾ[b]チオフエン環、ベンゾ[c]チオフエン環、インドール環、2H-イソインドール環、1H-インダゾール環、2H-インダゾール環、ベンゾオキサゾール環、1,2-ベンゾイソオキサゾール環、2,1-ベンゾイソオキサゾール環、ベンゾチアゾール環、1,2-ベンゾイソチアゾール環、2,1-ベンゾイソチアゾール環、1,2,3-ベンゾオキサジアゾール環、2,1,3-ベンゾオキサジアゾール環、1,2,3-ベンゾチアジアゾール環、2,1,3-ベンゾチアジアゾール環、1H-ベンゾトリアゾール環、

2H-ベンゾトリアゾール環、キノリン環、イソキノリン環、シンノリン環、キナゾリン環、キノキサリン環、フタラジン環、ナフチリジン環、1H-1,5-ベンゾジアゼピン環、カルバゾール環、 $\alpha$ -カルボリン環、 $\beta$ -カルボリン環、 $\gamma$ -カルボリン環、アクリジン環、フェノキサジン環、フェノチアジン環、フェナジン環、フェナントリジン環、フェナントロリン環、チアントレン環、インドリジン環、フェノキサチイン環等の5ないし14員の単環式又は縮合多環式芳香族複素環が挙げられる。好適には、5ないし13員の単環式又は縮合多環式芳香族複素環であり、さらに好適には、チオフェン環、ピリジン環、インドール環、キノキサリン環、及びカルバゾール環である。

上記環Zの定義における「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のヘテロアレーン上での置換位置は特に限定されない。また、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なってもよい。

上記環Zの定義における「式-O-A（式中、Aは上記定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは上記定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子である。

Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」の「アリール基」としては、上記「炭化水素基」の定義における「アリール基」と同様の基が挙げられ、好適には、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等のC<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>のアリール基であり、最も好適には、フェニル基である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のアリール基上での置換位置は特に限定されず、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なってもよい。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「置換基を有していてもよいフェニル基」である場合、好適には、「モノ置換フェニル基」、「ジ置換フェニル基」、及び「3個以上の置換基を有するフェニル基」であり、更に好適には、「ジ置換フェニル基」である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「ジ置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta - 1 e$ 」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta - 1 e$ ] 3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 4-プロピレンジオキシフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジヒドロキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 5-ビス[(1, 1-ジメチル)エチル]フェニル基、2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、4-クロロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-ブromo-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-ニトロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-シアノ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-メトキシ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(1-ピロリジニル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 5-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3,

5-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジニトロフェニル基、2, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、5- [(1, 1-ジメチル) エチル] -2-メトキシフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、4-メトキシビフェニル-3-イル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ビス (メトキシカルボニル) フェニル基、2-ブロモ-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3-メトキシカルボニル-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3-カルボキシ-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (2-ナフチルオキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (2, 4-ジクロロフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- [4- (トリフルオロメチル) ピペリジン-1-イル] -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (2, 2, 2-トリフルオロエトキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (2-メトキシフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (4-クロロ-3, 5-ジメチルフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- ピペリジノ-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (4-メチルフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (4-クロロフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3, 5-ジカルボキシフェニル基、5-イソプロピル-2-メチルフェニル基、2, 5-ジエトキシフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、5-クロロ-2-シアノ基、5-ジエチルスルファモイル-2-メトキシフェニル基、2-クロロ-5-ニトロフェニル基、2-メトキシ-5- (フェニルカルバモイル) フェニル基、5-アセチルアミノ-2-メトキシフェニル基、5-メトキシ-2-メチルフェニル基、2, 5-ジブトキシフェニル基、2, 5-ジイソペンチルオキシ基、5-カルバモイル-2-メトキシフェニル基、5- [(1, 1-ジメチル) プロピル] -2-フェノキシフェニル基、2-ヘキシルオキシ-5-メタンスルホニル基、5- (2, 2-ジメチルプロピオニル) -2-メチルフェニル基、5-メトキシ-2- (1-ピロリル) フェニル基、5-クロロ-2- (p-トルエンスルホニル) フェニル基、2-クロロ-5- (p-トルエンスルホニル) フェニル基、2-フルオロ-5-



メタンスルホニル基、2-メトキシ-5-フェノキシ基、4-メチルビフェニル-3-イル基、2-メトキシ-5-(1-メチル-1-フェニルエチル)フェニル基、5-モルホリノ-2-ニトロフェニル基、5-フルオロ-2-(1-イミダゾリル)フェニル基、2-ブチル-5-ニトロフェニル基、5-[(1, 1-ジメチル)]プロピル-2-ヒドロキシフェニル基、2-メトキシ-5-メチルフェニル基、2, 5-ジフルオロフェニル基、4-イソプロピル-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-ブromo-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-ブromo-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ブromo-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-イソプロポキシ-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-シアノ-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 6-ジイソプロピルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 4-ジメチルフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、インダン-5-イル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、4-ブromo-2-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3, 4-エチレンジオキシフェニル基、3-クロロ-4-シアノフェニル基、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2-クロロ-4-シアノフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、4-イソプロピル-3-メチルフェニル基、4-[(1, 1-ジメチル)プロピル]-2-ヒドロキシフェニル基、3-クロロ-2-シアノフェニル基、2-シアノ-4-メチルフェニル基、2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-4-イル基、2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキセン-5-イル基、3-クロロ-4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル基、2-ニトロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル基、2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、4-ブromo-2-フルオロフェニル基、2, 4-ビス(メタンスルホニル)フェニル基、2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-1, 4-ベンゾジオキセン-6-イル基、

2-ベンゾイル-4-クロロフェニル基、2-ブロモ-4-フルオロフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-ニトロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2-ベンゾイル-5-メチルフェニル基、2-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3, 4-ジヘキシルオキシフェニル基、2, 4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、4-シアノ-2-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2-(4-シアノフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「ジ置換フェニル基」である場合、更に好適には、「2, 5-ジ置換フェニル基」及び「3, 5-ジ置換フェニル基」である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「2, 5-ジ置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta-2e$ 」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta-2e$ ] 2, 5-ジメトキシフェニル基、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(1-ピロリジニル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 5-ジクロロフェニル基、2, 5-ビス[(1, 1-ジメチル)エチル]フェニル基、5-[(1, 1-ジメチル)エチル]-2-メトキシフェニル基、4-メトキシビフェニル-3-イル基、2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2-ナフチルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-5-(トリフ

ルオロメチル) フェニル基、2-[4-(トリフルオロメチル) ピペリジン-1-イル]-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-クロロ-3, 5-ジメチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-ピペリジノ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-メチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、5-イソプロピル-2-メチルフェニル基、2, 5-ジエトキシフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、5-クロロ-2-シアノ基、5-ジエチルスルファモイル-2-メトキシフェニル基、2-クロロ-5-ニトロフェニル基、2-メトキシ-5-(フェニルカルバモイル) フェニル基、5-アセチルアミノ-2-メトキシフェニル基、5-メトキシ-2-メチルフェニル基、2, 5-ジブトキシフェニル基、2, 5-ジイソペンチルオキシ基、5-カルバモイル-2-メトキシフェニル基、5-[(1, 1-ジメチル) プロピル]-2-フェノキシフェニル基、2-ヘキシルオキシ-5-メタンスルホニル基、5-(2, 2-ジメチルプロピオニル)-2-メチルフェニル基、5-メトキシ-2-(1-ピロリル) フェニル基、5-クロロ-2-(p-トルエンスルホニル) フェニル基、2-クロロ-5-(p-トルエンスルホニル) フェニル基、2-フルオロ-5-メタンスルホニル基、2-メトキシ-5-フェノキシ基、2-メトキシ-5-(1-メチル-1-フェニルエチル) フェニル基、5-モルホリノ-2-ニトロフェニル基、5-フルオロ-2-(1-イミダゾリル) フェニル基、2-ブチル-5-ニトロフェニル基、5-[(1, 1-ジメチル) プロピル]-2-ヒドロキシフェニル基、2-メトキシ-5-メチルフェニル基、2, 5-ジフルオロフェニル基、2-ベンゾイル-5-メチルフェニル基、2-(4-シアノフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「2, 5-ジ

置換フェニル基」である場合、更に好適には、「2, 5-ジ置換フェニル基 (但し、該置換基の少なくとも1個はトリフルオロメチル基である)」であり、特に更に好適には、下記「置換基群  $\delta - 3 e$ 」から選択される基であり、最も好適には、2, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基である。

[置換基群  $\delta - 3 e$ ] 2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メチル-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(1-ピロリジニル)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2-ナフチルオキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-[4-(トリフルオロメチル) ピペリジン-1-イル]-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2, 2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-クロロ-3, 5-ジメチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-ピペリジノ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-メチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-シアノフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「3, 5-ジ置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta - 4 e$ 」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta - 4 e$ ] 3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基、3, 5

ージクロロフェニル基、3, 5-ビス[(1, 1-ジメチル)エチル]フェニル基、3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジニトロフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ビス(メトキシカルボニル)フェニル基、3-メトキシカルボニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-カルボキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 5-ジカルボキシフェニル基

上記「置換基を有していてもよいアリール基」が「3, 5-ジ置換フェニル基」である場合、更に好適には、「3, 5-ジ置換フェニル基(但し、該置換基の少なくとも1個はトリフルオロメチル基である)」であり、特に更に好適には、下記「置換基群  $\delta-5e$ 」から選択される基であり、最も好適には、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である。

[置換基群  $\delta-5e$ ] 3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メトキシカルボニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-カルボキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「モノ置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta-6e$ 」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta-6e$ ] 4-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、2-メトキシフェニル基、2-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-クロロフェニル基、ビフェニル-3-イル基、3-アセチルフェニル基、3-(アセチルアミノ)フェニル基、3-カルバモイルフェニル基、3-メチルカルバモイルフェニル基、4-メチルフェニル基、3-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、

2-ベンジルフェニル基、4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]フェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-シクロヘキシルフェニル基、4-ベンジルフェニル基、2-クロロフェニル基、2-メチルフェニル基、4-ブチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-(エトキシカルボニルメチル)フェニル基、3-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル基、4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル基、4-(トリフルオロメタンスルホニル)フェニル基、3-エチニルフェニル基、4-(1-メチルプロピル)フェニル基、3-ベンゾイルフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-(アセチルアミノ)フェニル基、4-スルファモイルフェニル基、4-(ジフルオロメトキシ)フェニル基、3-メチルスルファニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、3-(ブチルスルファモイル)フェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、4-(p-トルエンスルホニルアミノ)フェニル基、4-モルホリノフェニル基、3-[(1, 1-ジメチル)エチル]フェニル基、3-(5-メチルフラン-2-イル)フェニル基、3-スルファモイルフェニル基、3-(トリフルオロメタンスルホニル)フェニル基、3-ヘキシルオキシフェニル基、4-アセチルフェニル基、ビフェニル-2-イル基、ビフェニル-4-イル基、3-[5-フェニル-3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]フェニル基、3-{5-[(1, 1-ジメチル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル}フェニル基、4-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]フェニル基、3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]フェニル基、4-[5-フェニル-3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「3個以上の置換基を有するフェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置

換基群 δ-7 e」に示す基が挙げられる。

〔置換基群 δ-7 e〕 3, 5-ビス(トリフルオロメチル)-2-ブロモフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、3, 5-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、3, 5, 5, 8, 8-ペンタメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル基、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)-2-メチルフェニル基、2, 6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 4-ジメトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 4-ジフルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-クロロ-2-(4-クロロベンゼンスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、5-クロロ-2-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 3-ジフルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-シアノ-4, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4-ジクロロ-5-イソプロポキシフェニル基、2, 3, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 5-トリクロロフェニル基、5-エトキシ-4-フルオロ-2-ニトロフェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「置換基を有していてもよいナフチル基」である場合、好適な基の具体例としては、1-ナフチル基、4-メトキシナフタレン-2-イル基、及び4-ヒドロキシ-3-メチルナフタレン-1-イル基が挙げられる。

Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」の「ヘテロアリール基」としては、上記「ヘテロ環基」の定義における「単環式ヘテロアリール基」及び「縮合多環式ヘテロアリール基」と同様の基が挙げられる。好適には、5ないし13員のヘテロアリール基であり、このとき、好適な基の具体例としては、チエニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、インドリル基、キノリル基、カルバゾリル基、チアゾリル基、及びピラジニル基が挙げられる。

Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」の「ヘテロアリール基」としては、更に好適には、5員のヘテロアリール基であり、特に更に好適には、チエニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、及びチアゾリル基であり、最も好適には、チアゾリル基である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のヘテロアリール基上での置換位置は特に限定されず、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なっているともよい。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」が「置換基を有していてもよいチアゾリル基」である場合、好適には、「置換基を有していてもよいチアゾール-2-イル基」であり、更に好適には、「モノ置換チアゾール-2-イル基」、及び「ジ置換チアゾール-2-イル基」であり、特に更に好適には、「ジ置換チアゾール-2-イル基」である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」が「ジ置換チアゾール-2-イル基」である場合、好適には、下記「置換基群  $\delta-8e$ 」から選択される基であり、最も好適には、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-[(2, 2-ジメチル)プロピオニル]チアゾール-2-イル基である。

「置換基群  $\delta-8e$ 」5-ブromo-4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル基、5-ブromo-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-シアノ-4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル基、5-メチルチアゾール-2-イル基、4, 5-ジメチルチアゾール-2-イル基、5-メチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-(4-フルオロフェニル)-4-メチルチアゾール-2-イル基、4-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]チアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-エチルチアゾール-2-イル基、4-エチル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、4-イソプロピル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、



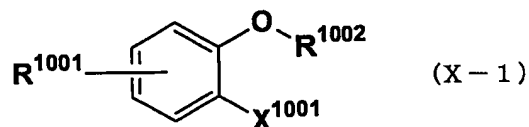
4-ブチル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-[(2, 2-ジメチル)プロピオニル]チアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-(エトキシカルボニル)チアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-ピペリジノチアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-モルホリノチアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-(4-メチルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]-5-(4-フェニルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル基、5-カルボキシメチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、4, 5-ジフェニルチアゾール-2-イル基、4-ベンジル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、5-フェニル-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-アセチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-ベンゾイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-(ペンタフルオロフェニル)チアゾール-2-イル基、5-メチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-イソプロピルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-(2-フェニルエチル)カルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-カルボキシ-4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル基、5-(エトキシカルボニル)メチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-カルボキシ-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-プロピルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」が「モノ置換チアゾール-2-イル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta-9e$ 」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta-9e$ ] 4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル

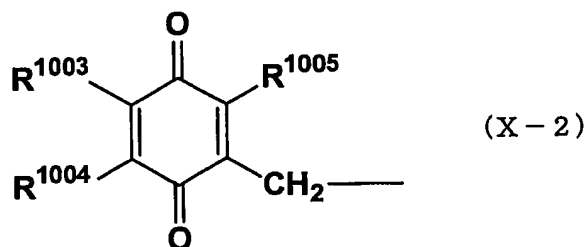
基、4-フェニルチアゾール-2-イル基、4-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]チアゾール-2-イル基、4-(2,4-ジクロロフェニル)チアゾール-2-イル基、4-(3,4-ジクロロフェニル)チアゾール-2-イル基、4-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]チアゾール-2-イル基、4-(2,5-ジフルオロフェニル)チアゾール-2-イル基、4-(4-メトキシフェニル)チアゾール-2-イル基、4-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]チアゾール-2-イル基、4-(ペンタフルオロフェニル)チアゾール-2-イル基

上記一般式(I)で表される化合物としては、好適には、「下記一般式(X-1)で表される置換安息香酸誘導体、及び／又は下記化合物群φ-1で表される化合物」以外の化合物である。

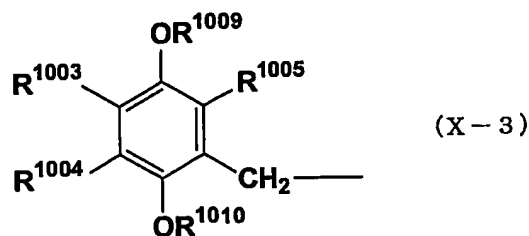


(式中、

R<sup>1001</sup>は、下記的一般式(X-2)：



または、下記的一般式(X-3)：



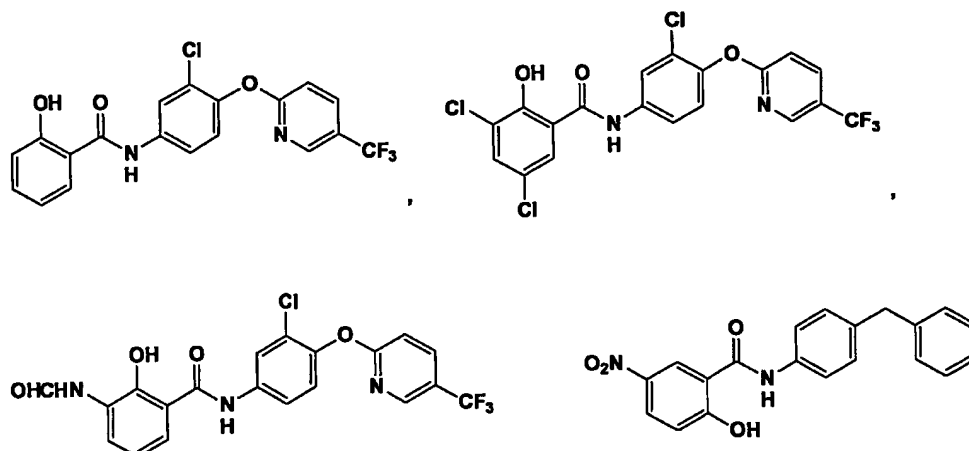
(式中、R<sup>1003</sup>、R<sup>1004</sup>およびR<sup>1005</sup>は各々独立に水素原子、炭素数1～6の

アルキル基または炭素数 1～6 のアルコキシ基であり、 $R^{1009}$  および  $R^{1010}$  は各々独立に水素原子、炭素数 1～6 のアルキル基または炭素数 2～11 のアシル基を示す) であり；

$R^{1002}$  は、水素原子、置換されていてもよい炭素数 1～6 の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数 6～12 のアリール基、置換されていてもよい炭素数 4～11 のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数 7～14 のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数 5～13 のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは炭素数 2～11 のアシル基であり；

$X^{1001}$  は、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基を示す。)

[化合物群  $\phi-1$ ]



上記一般式 (I) で表される化合物は塩を形成することができる。薬理的に許容される塩としては、酸性基が存在する場合には、例えば、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩等の金属塩、又はアンモニウム塩、メチルアンモニウム塩、ジメチルアンモニウム塩、トリメチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩等のアンモニウム塩をあげることができる。塩基性基が存在する場合には、例えば、塩酸塩、臭酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の鉱酸塩、あるいはメタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酒石酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、

マンデル酸塩、ケイ皮酸塩、乳酸塩等の有機酸塩をあげることができる。グリシンなどのアミノ酸と塩を形成する場合もある。本発明の医薬の有効成分としては、薬学的に許容される塩も好適に用いることができる。

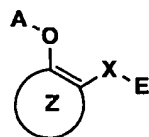
上記一般式 (I) で表される化合物又はその塩は、水和物又は溶媒和物として存在する場合もある。本発明の医薬の有効成分としては、上記のいずれの物質を用いてもよい。さらに一般式 (I) で表される化合物は1以上の不斉炭素を有する場合があり、光学活性体やジアステレオマーなどの立体異性体として存在する場合がある。本発明の医薬の有効成分としては、純粋な形態の立体異性体、光学対掌体又はジアステレオマーの任意の混合物、ラセミ体などを用いてもよい。

また、一般式 (I) で表される化合物が例えば2-ヒドロキシピリジン構造を有する場合、その互変異性体 (t a u t o m e r) である2-ピリドン構造として存在する場合がある。本発明の医薬の有効成分としては、純粋な形態の互変異性体又はそれらの混合物を用いてもよい。また、一般式 (I) で表される化合物がオレフィン性の二重結合を有する場合には、その配置はZ配置又はE配置のいずれでもよく、本発明の医薬の有効成分としてはいずれかの配置の幾何異性体又はそれらの混合物を用いてもよい。

本発明の医薬の有効成分として一般式 (I) に包含される化合物を以下に例示するが、本発明の医薬の有効成分は下記の化合物に限定されることはない。

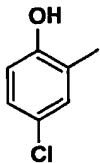
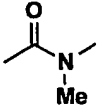
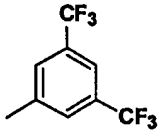
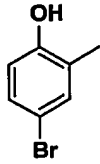
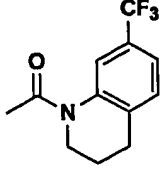
なお、下記表において用いられる略語の意味は下記の通りである。

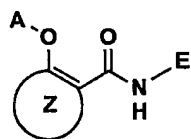
Me : メチル基、Et : エチル基。



化合物番号		X	E
1			
2			
3			
4			
5			
6			

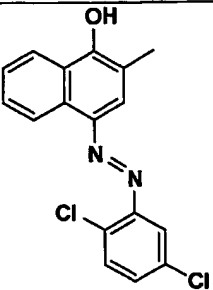
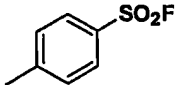
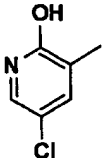
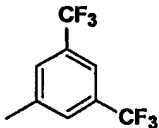
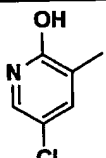
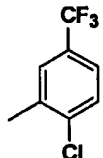
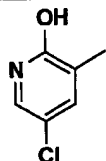
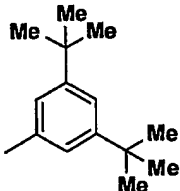
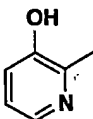
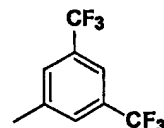
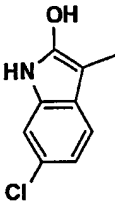
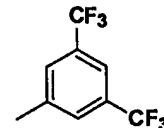
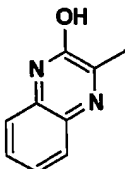
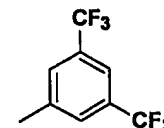
7			
8			
9			
10			
11			
12			
13			
14			
15			

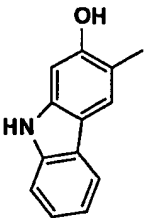
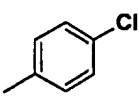
1 6			
1 7			

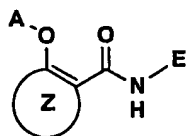


化合物番号		E
1 8		
1 9		
2 0		
2 1		
2 2		

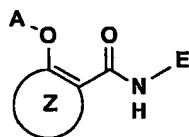


2 3		
2 4		
2 5		
2 6		
2 7		
2 8		
2 9		

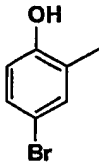
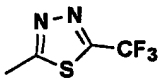
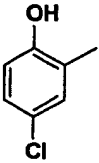
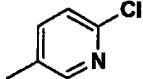
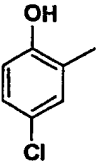
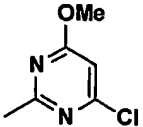
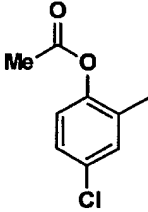
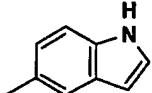
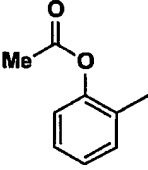
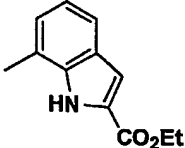
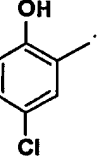
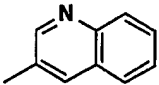
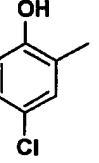
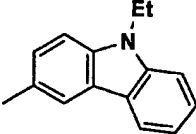
3 0	 <chem>Cc1cc(O)c2c(c1)c(c[nH]2)c3ccccc3</chem>	 <chem>Cc1ccc(Cl)cc1</chem>
-----	--	---

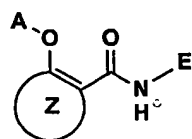


化合物番号		E
3 1		
3 2		
3 3		
3 4		

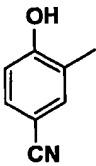
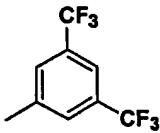
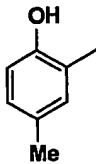
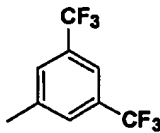
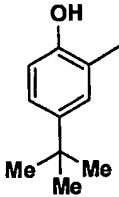
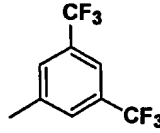
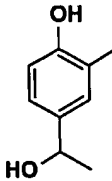
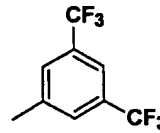
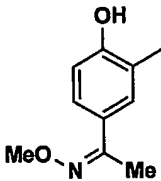
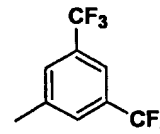
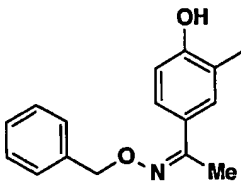
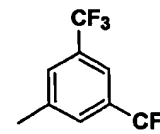
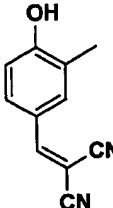
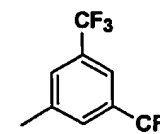


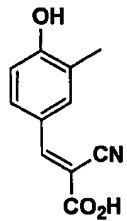
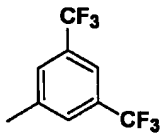
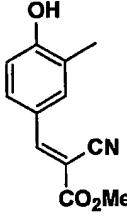
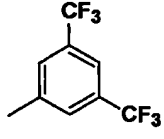
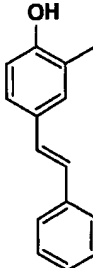
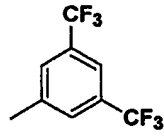
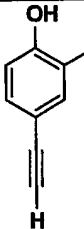
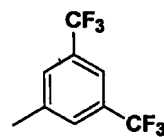
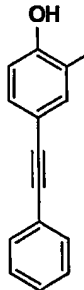
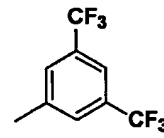
化合物番号		E
3 5		
3 6		
3 7		
3 8		
3 9		
4 0		

4 1		
4 2		
4 3		
4 4		
4 5		
4 6		
4 7		

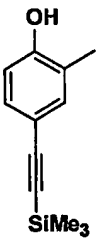
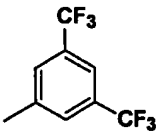
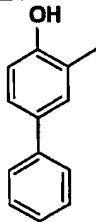
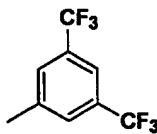
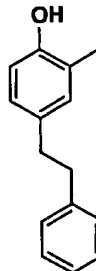
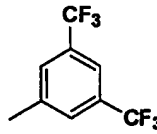
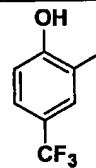
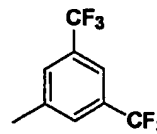
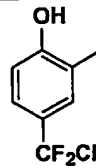
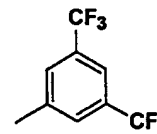
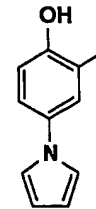
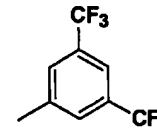


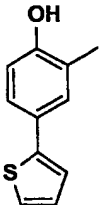
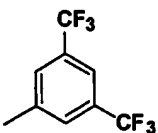
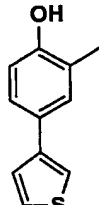
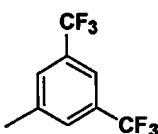
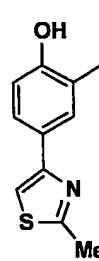
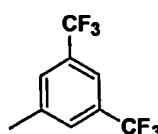
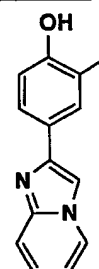
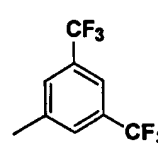
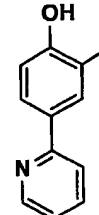
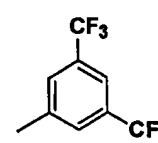
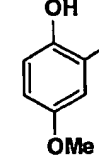
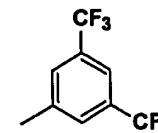
化合物番号		E
4 8		
4 9		
5 0		
5 1		
5 2		
5 3		

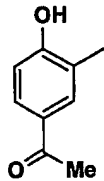
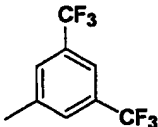
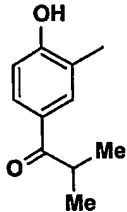
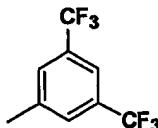
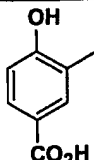
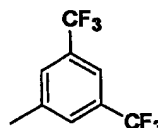
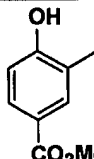
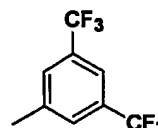
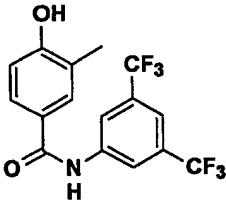
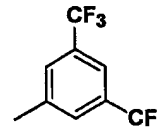
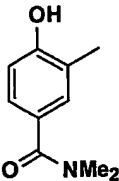
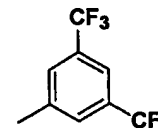
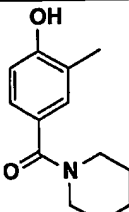
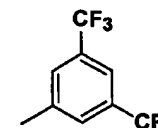
5 4		
5 5		
5 6		
5 7		
5 8		
5 9		
6 0		

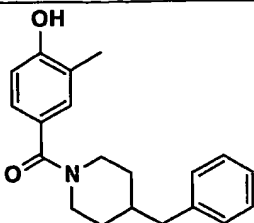
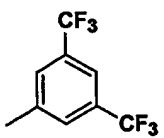
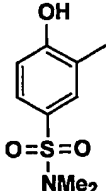
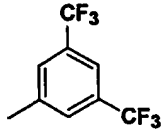
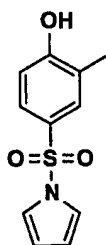
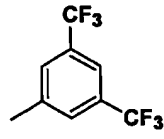
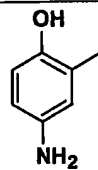
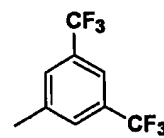
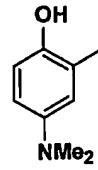
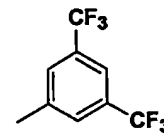
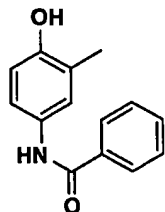
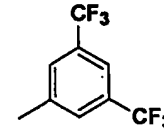
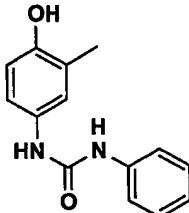
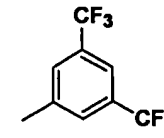
6 1	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C(=O)O)C(O)C#N</chem>	 <chem>CC1=CC(=CC=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F</chem>
6 2	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C(=O)OC)C(O)C#N</chem>	 <chem>CC1=CC(=CC=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F</chem>
6 3	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C(=O)OC)C(O)C=Cc2ccccc2</chem>	 <chem>CC1=CC(=CC=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F</chem>
6 4	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C#C)C(O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=CC=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F</chem>
6 5	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C#Cc2ccccc2)C(O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=CC=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F</chem>

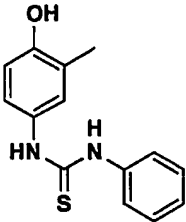
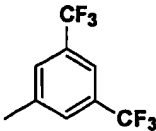
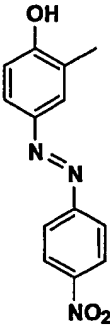
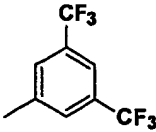
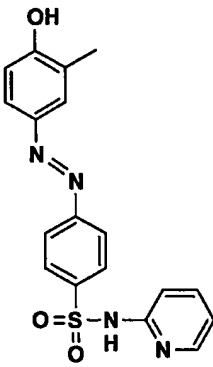
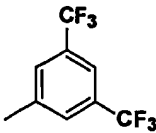
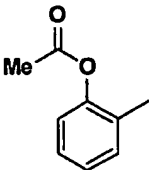
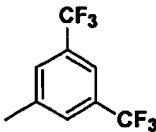
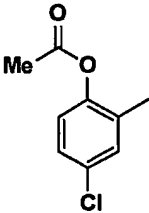
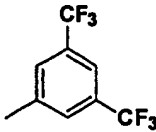


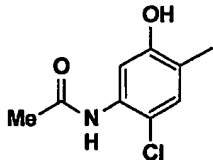
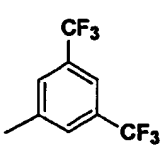
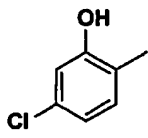
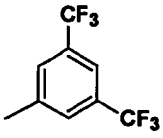
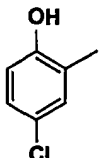
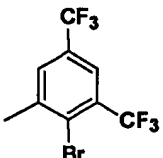
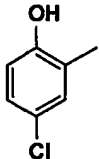
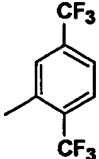
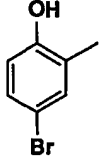
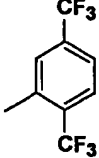
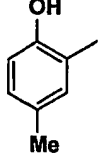
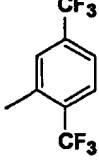
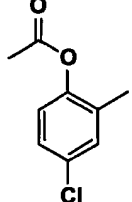
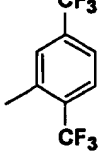
6 6		
6 7		
6 8		
6 9		
7 0		
7 1		

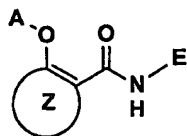
7 2		
7 3		
7 4		
7 5		
7 6		
7 7		

7 8		
7 9		
8 0		
8 1		
8 2		
8 3		
8 4		

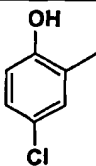
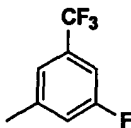
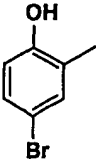
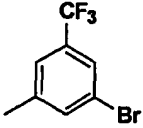
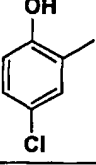
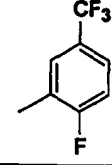
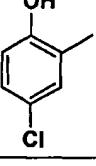
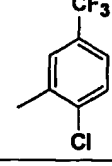
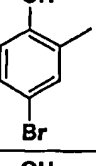
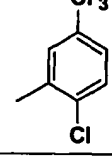
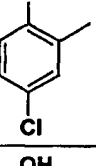
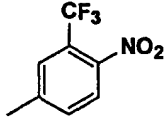
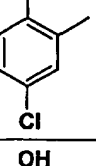
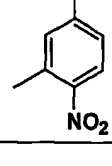
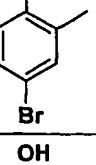
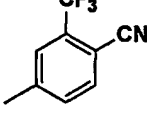
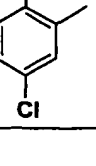
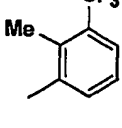
8 5	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C(=O)N2CCN(CC2Cc3ccccc3)C(=O)N4C=CC(=C(C=C4)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>
8 6	 <chem>CC1=CC=C(C=C1S(=O)(=O)N(C)C)C(=O)N2C=CC(=C(C=C2)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>
8 7	 <chem>CC1=CC=C(C=C1S(=O)(=O)N2C=CC=CC2)C(=O)N3C=CC(=C(C=C3)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>
8 8	 <chem>CC1=CC=C(C=C1N)C(=O)N2C=CC(=C(C=C2)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>
8 9	 <chem>CC1=CC=C(C=C1N(C)C)C(=O)N2C=CC(=C(C=C2)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>
9 0	 <chem>CC1=CC=C(C=C1NC(=O)c2ccccc2)C(=O)N3C=CC(=C(C=C3)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>
9 1	 <chem>CC1=CC=C(C=C1NC(=O)Nc2ccccc2)C(=O)N3C=CC(=C(C=C3)O)C</chem>	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1C(F)(F)F)C(F)(F)F)C</chem>

9 2		
9 3		
9 4		
9 5		
9 6		

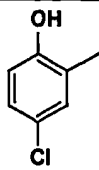
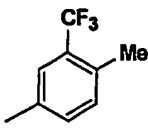
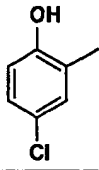
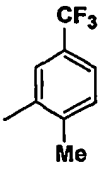
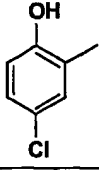
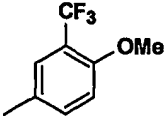
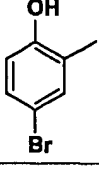
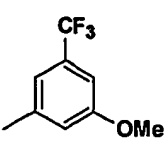
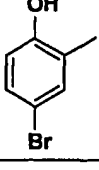
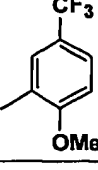
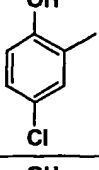
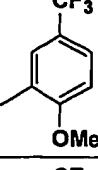
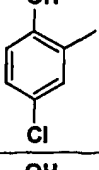
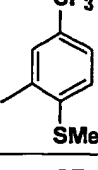
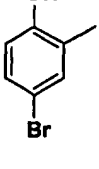
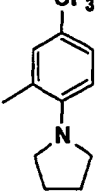
9 7		
9 8		
9 9		
1 0 0		
1 0 1		
1 0 2		
1 0 3		

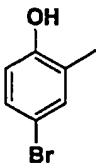
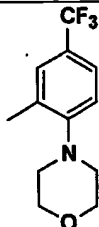
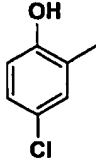
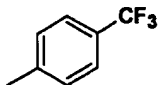
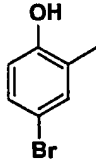
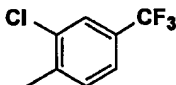
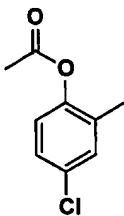
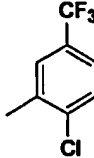
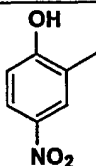
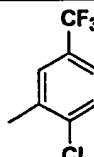
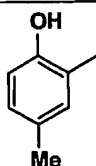
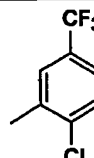
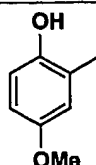
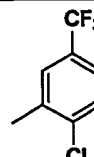
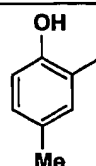
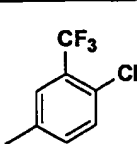


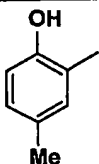
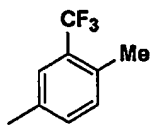
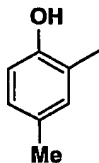
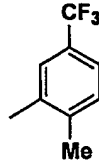
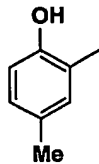
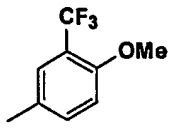
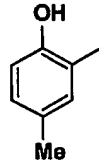
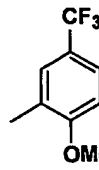
化合物番号		E
104		
105		
106		
107		
108		
109		

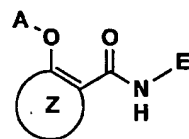
1 1 0		
1 1 1		
1 1 2		
1 1 3		
1 1 4		
1 1 5		
1 1 6		
1 1 7		
1 1 8		



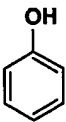
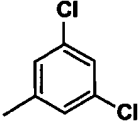
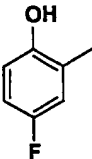
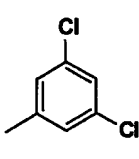
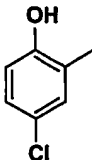
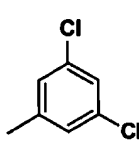
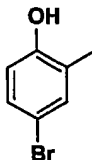
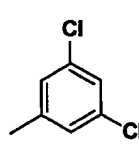
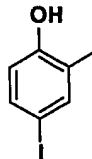
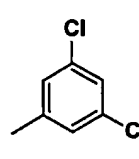
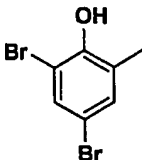
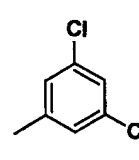
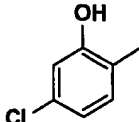
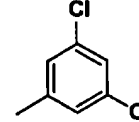
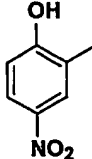
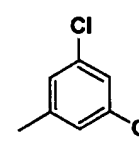
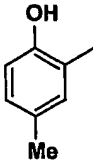
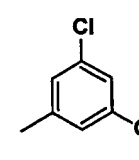
1 1 9		
1 2 0		
1 2 1		
1 2 2		
1 2 3		
1 2 4		
1 2 5		
1 2 6		

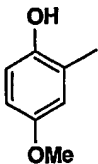
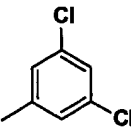
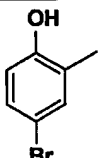
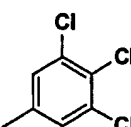
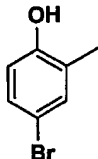
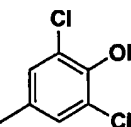
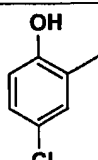
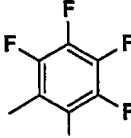
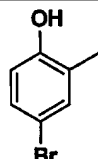
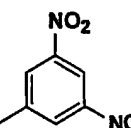
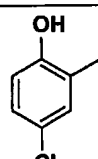
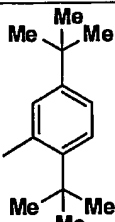
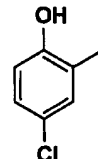
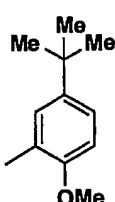
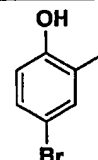
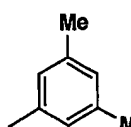
1 2 7		
1 2 8		
1 2 9		
1 3 0		
1 3 1		
1 3 2		
1 3 3		
1 3 4		

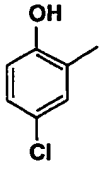
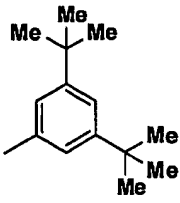
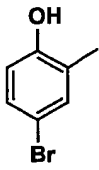
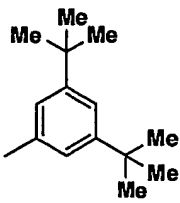
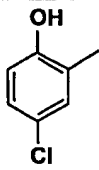
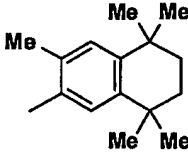
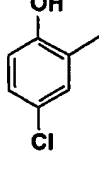
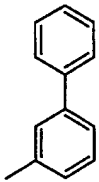
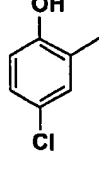
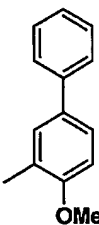
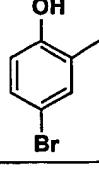
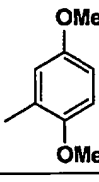
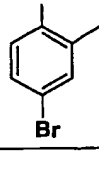
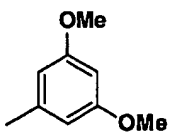
1 3 5		
1 3 6		
1 3 7		
1 3 8		

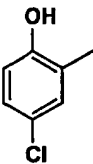
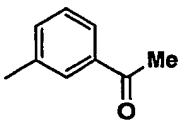
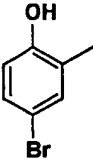
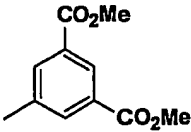
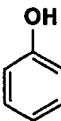
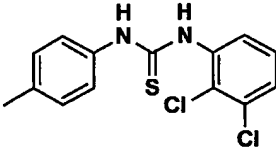
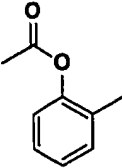
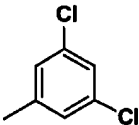
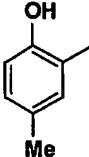
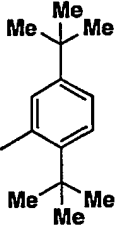
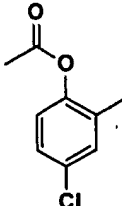
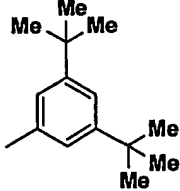
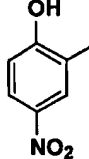
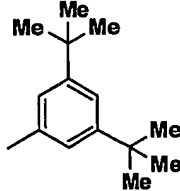


化合物番号		E
1 3 9		
1 4 0		
1 4 1		
1 4 2		
1 4 3		
1 4 4		

1 4 5		
1 4 6		
1 4 7		
1 4 8		
1 4 9		
1 5 0		
1 5 1		
1 5 2		
1 5 3		

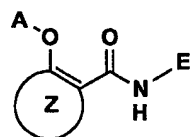
1 5 4		
1 5 5		
1 5 6		
1 5 7		
1 5 8		
1 5 9		
1 6 0		
1 6 1		

1 6 2		
1 6 3		
1 6 4		
1 6 5		
1 6 6		
1 6 7		
1 6 8		

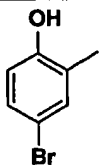
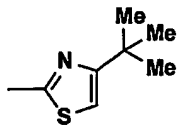
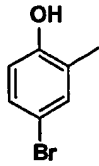
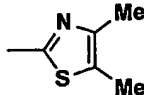
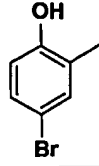
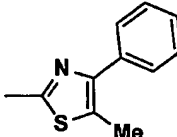
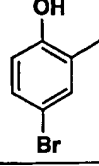

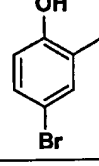
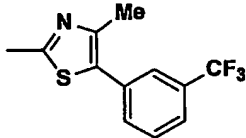
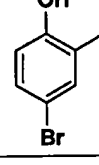
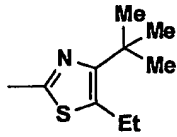
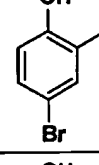
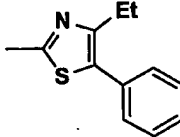
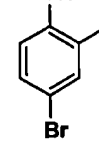
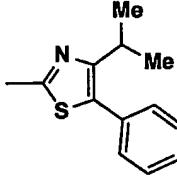
1 6 9		
1 7 0		
1 7 1		
1 7 2		
1 7 3		
1 7 4		
1 7 5		

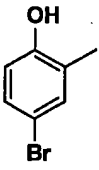
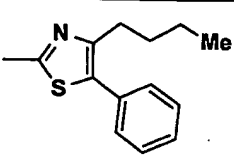
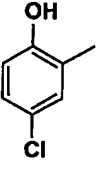
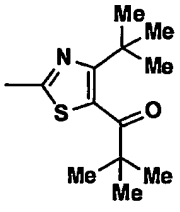
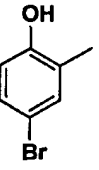
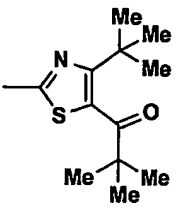
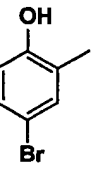
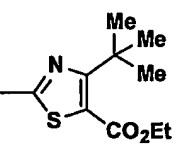
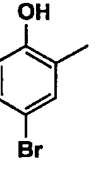
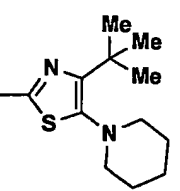
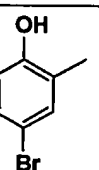
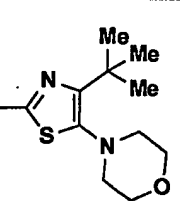
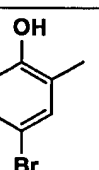
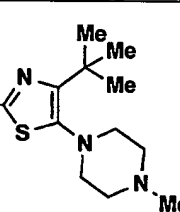


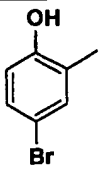
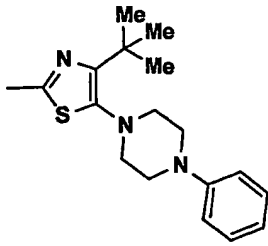
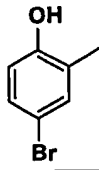
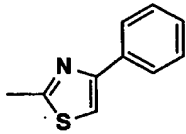
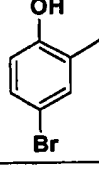
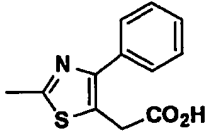
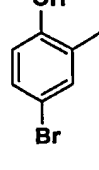
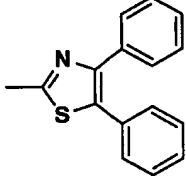
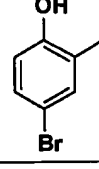
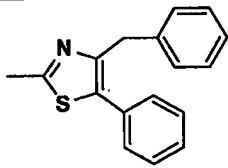
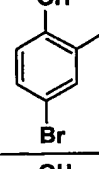
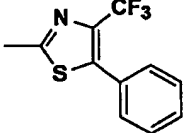
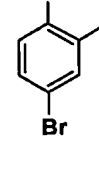
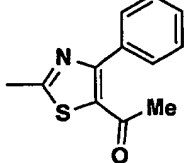
1 7 6	 <chem>Cc1cccc(O)c1</chem>	 <chem>CC(C)(C)c1cc(C)c(C(C)(C)C)c(C)c1</chem>
1 7 7	 <chem>COc1cccc(O)c1</chem>	 <chem>CC(C)(C)c1cc(C)c(C(C)(C)C)c(C)c1</chem>
1 7 8	 <chem>CC(=O)Oc1cc(C)c(Cl)cc1</chem>	 <chem>COc1cc(C)c(C(C)(C)C)c(C(C)(C)C)c1</chem>
1 7 9	 <chem>Cc1cccc(O)c1</chem>	 <chem>COc1cc(C)c(C(C)(C)C)c(C(C)(C)C)c1</chem>

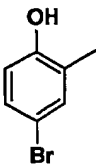
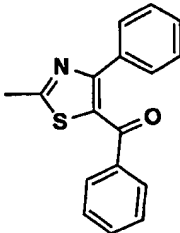
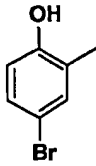
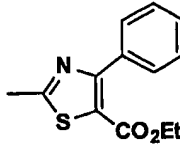
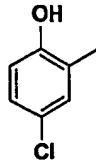
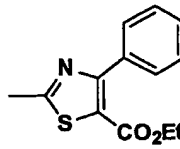
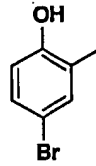
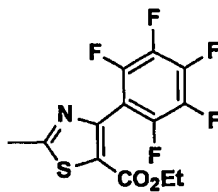
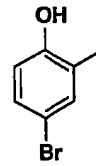
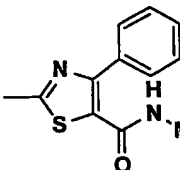
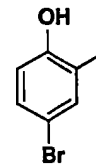
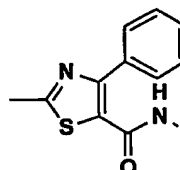
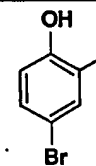
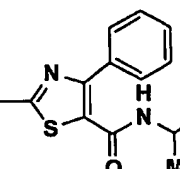


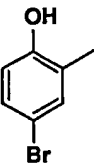
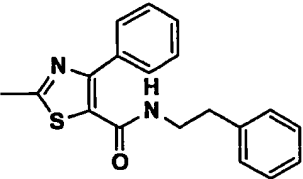
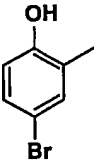
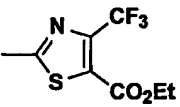
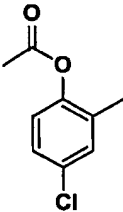
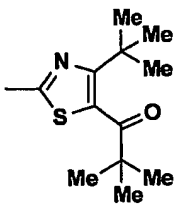
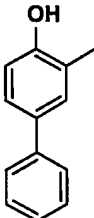
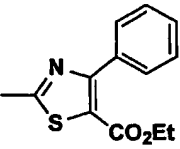
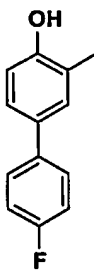
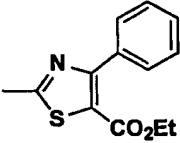
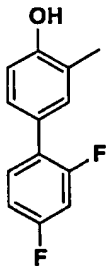
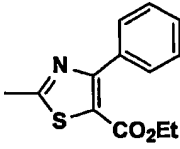
化合物番号		E
180		
181		
182		
183		
184		
185		

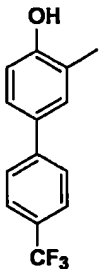
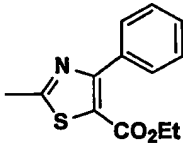
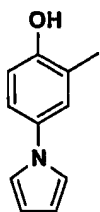
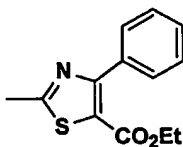
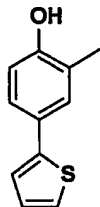
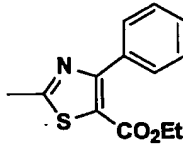
186		
187		
188		
189		
190		
191		
192		
193		

194		
195		
196		
197		
198		
199		
200		

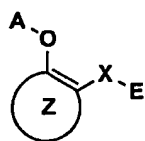
201		
202		
203		
204		
205		
206		
207		

208		
209		
210		
211		
212		
213		
214		

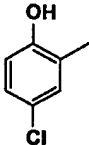
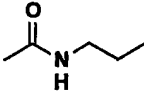
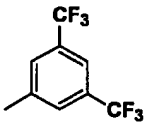
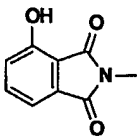
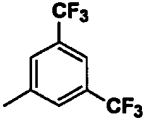
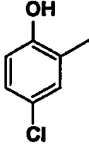
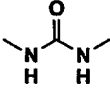
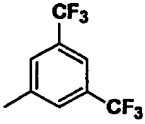
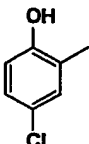

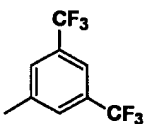
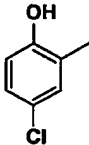
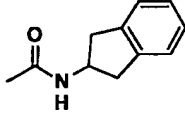
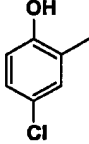

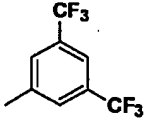
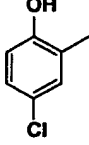
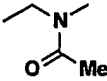
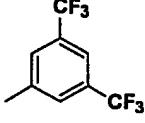
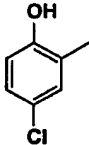
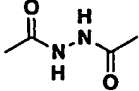
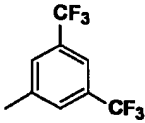
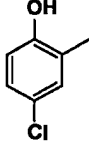
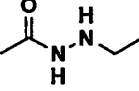
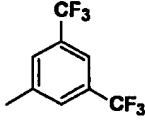
2 1 5		
2 1 6		
2 1 7		
2 1 8		
2 1 9		
2 2 0		

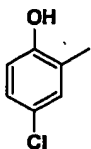

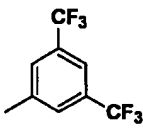
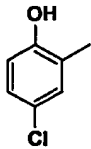
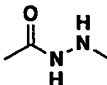
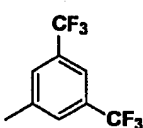
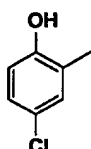
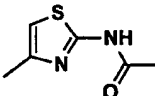
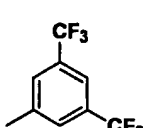
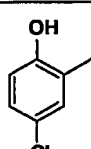
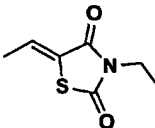
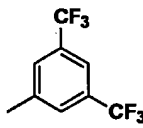
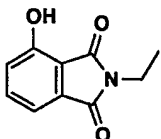
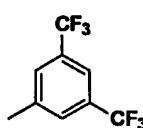
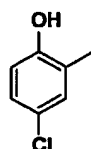
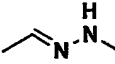
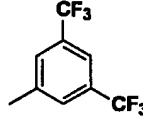
2 2 1	 <chem>Cc1cc(O)ccc1-c2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	 <chem>CCOC(=O)c1c(C)nc(C)c1-c2ccccc2</chem>
2 2 2	 <chem>Cc1cc(O)ccc1-c2cc[nH]2</chem>	 <chem>CCOC(=O)c1c(C)nc(C)c1-c2ccccc2</chem>
2 2 3	 <chem>Cc1cc(O)ccc1-c2ccsc2</chem>	 <chem>CCOC(=O)c1c(C)nc(C)c1-c2ccccc2</chem>

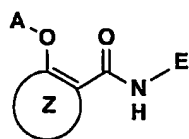




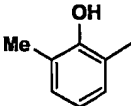
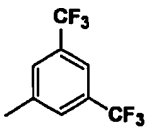
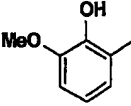
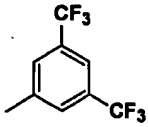
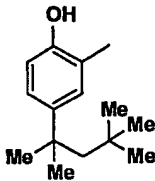
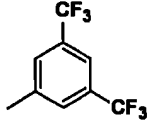

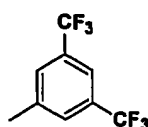
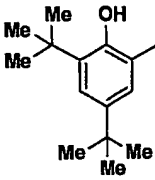
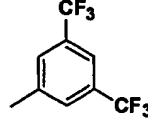
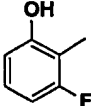
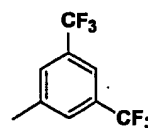
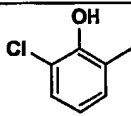
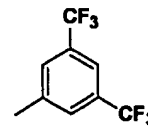
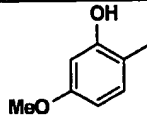
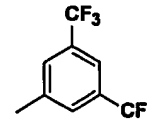
化合物番号		X	E
301			
302			
303			
304			
305			
306			

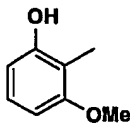
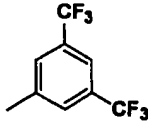
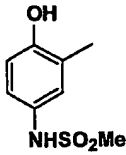
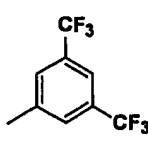
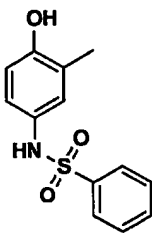
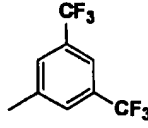
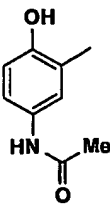
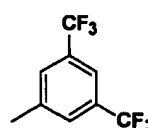
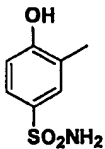
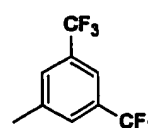
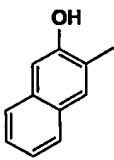
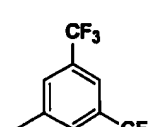
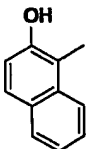
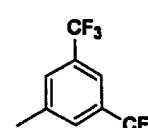
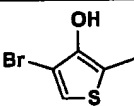
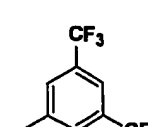
3 0 7			
3 0 8			
3 0 9			
3 1 0			
3 1 1			
3 1 2			
3 1 3			
3 1 4			
3 1 5			

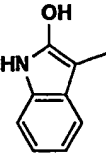
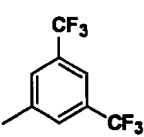
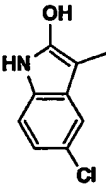
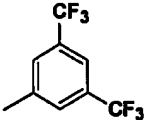
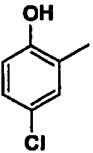
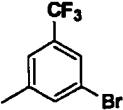
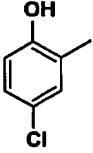
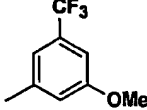
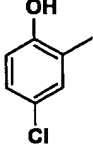
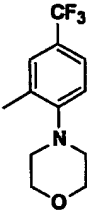
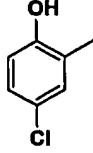
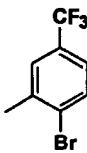
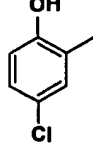
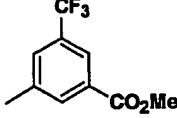
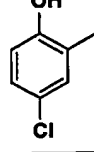
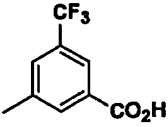
3 1 6			
3 1 7			
3 1 8			
3 1 9			
3 2 0			
3 2 1			

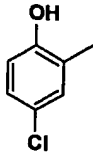
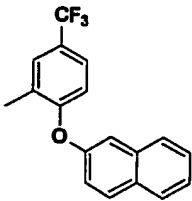
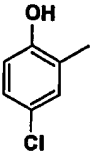
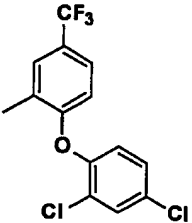
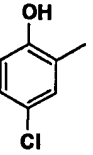
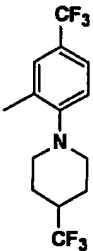
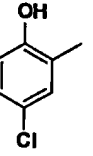

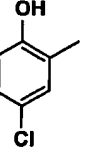
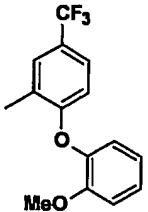
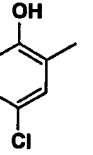
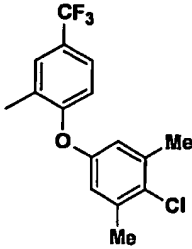


化合物番号		E
3 2 2		
3 2 3		
3 2 4		
3 2 5		
3 2 6		
3 2 7		

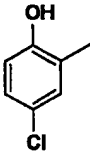
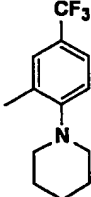
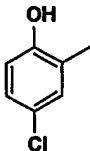
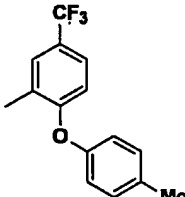
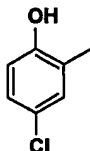
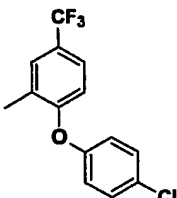
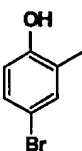
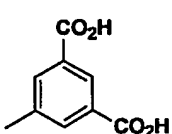
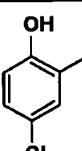
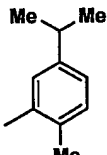
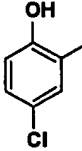
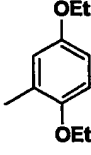
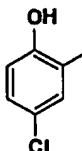
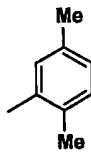
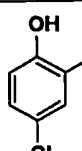
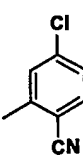
3 2 8		
3 2 9		
3 3 0		
3 3 1		
3 3 2		
3 3 3		
3 3 4		
3 3 5		

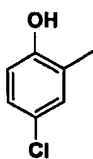
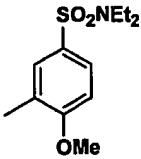
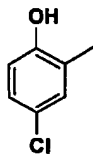
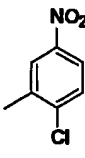
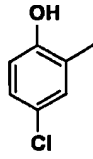
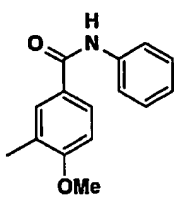
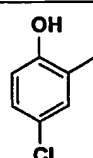
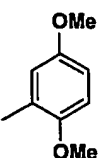
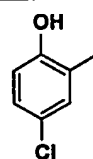
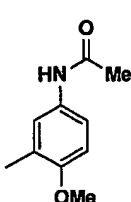
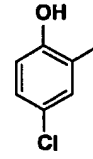
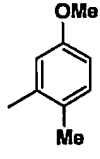
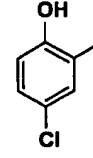
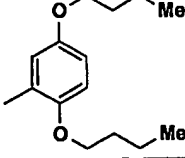
3 3 6		
3 3 7		
3 3 8		
3 3 9		
3 4 0		
3 4 1		
3 4 2		
3 4 3		

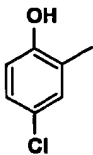
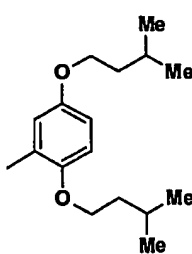
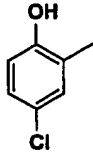
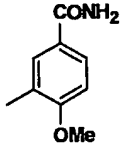
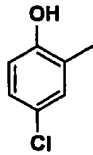
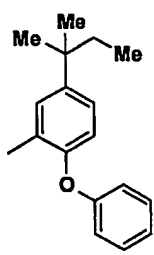
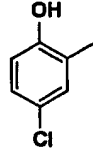
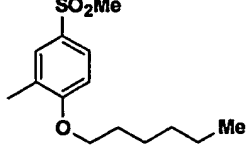
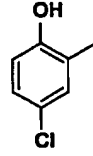
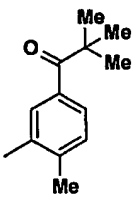
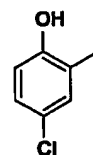
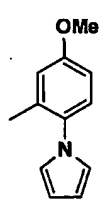
3 4 4		
3 4 5		
3 4 6		
3 4 7		
3 4 8		
3 4 9		
3 5 0		
3 5 1		

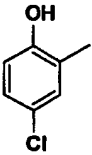
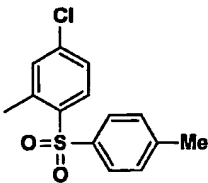
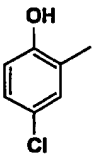
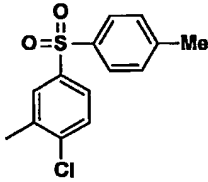
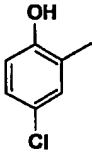
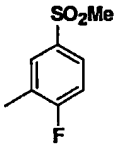
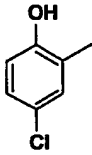
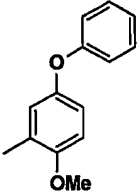
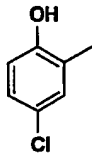
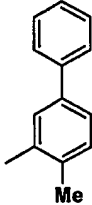
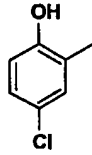
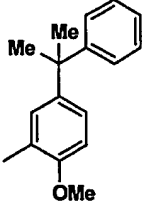
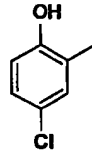
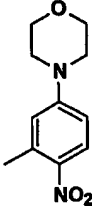
3 5 2		
3 5 3		
3 5 4		
3 5 5		
3 5 6		
3 5 7		

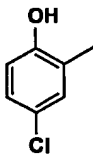
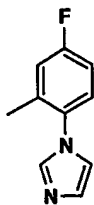
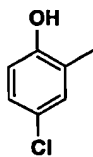
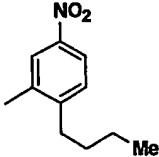
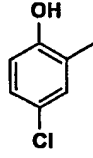
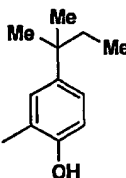
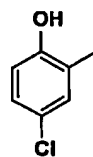
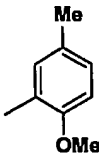
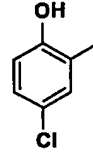
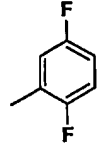
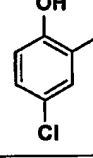
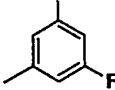
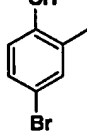

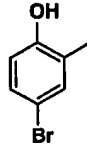
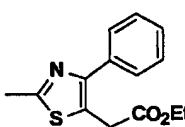


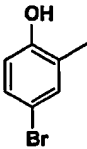
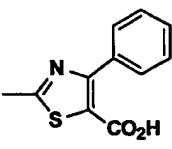
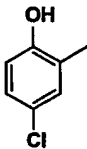
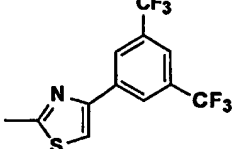
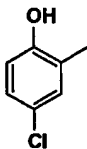

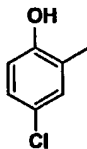
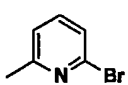
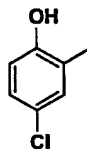

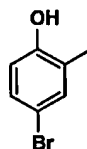
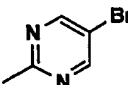
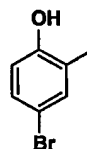
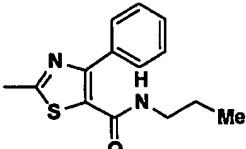
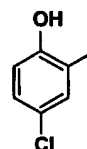
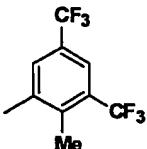
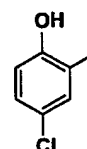
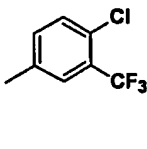
3 5 8		
3 5 9		
3 6 0		
3 6 1		
3 6 2		
3 6 3		
3 6 4		
3 6 5		

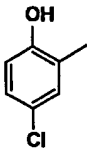
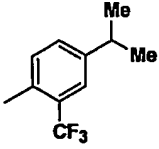
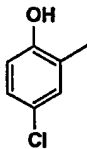
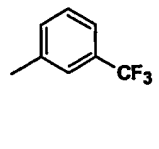
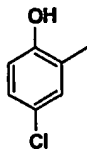
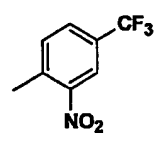
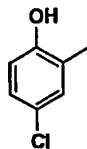
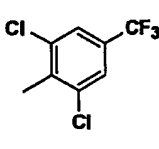
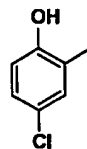
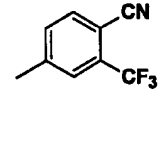
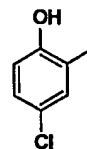
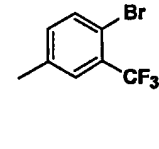
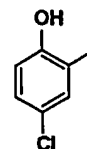
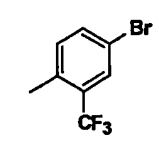
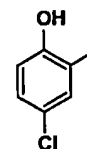
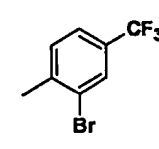
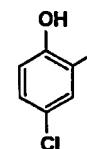
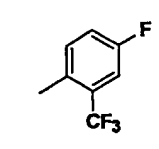
3 6 6		
3 6 7		
3 6 8		
3 6 9		
3 7 0		
3 7 1		
3 7 2		

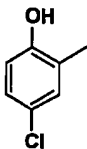
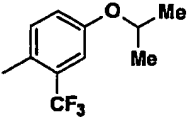
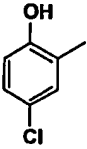
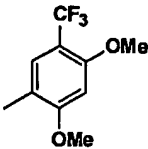
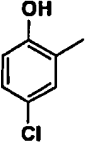
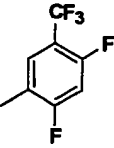
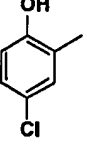
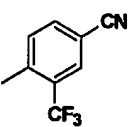
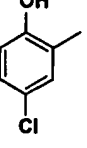
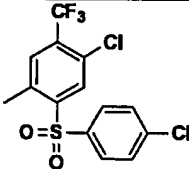
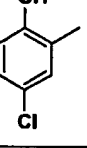

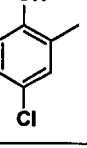
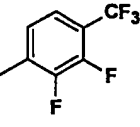
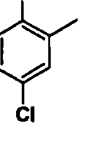
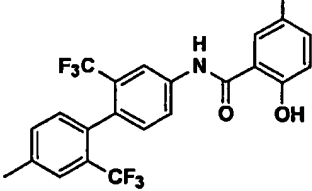
3 7 3		
3 7 4		
3 7 5		
3 7 6		
3 7 7		
3 7 8		

3 7 9		
3 8 0		
3 8 1		
3 8 2		
3 8 3		
3 8 4		
3 8 5		

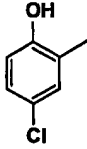
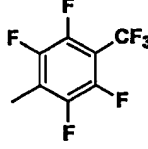
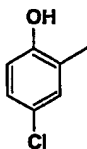
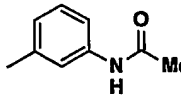
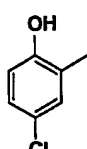
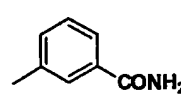
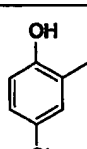
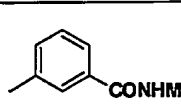
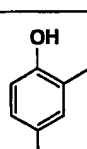
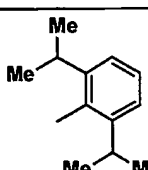
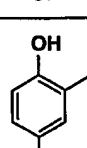
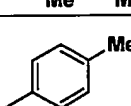
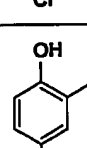
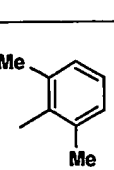
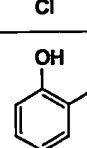
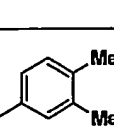
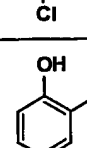
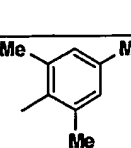
3 8 6		
3 8 7		
3 8 8		
3 8 9		
3 9 0		
3 9 1		
3 9 2		
3 9 3		

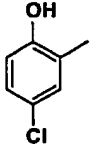
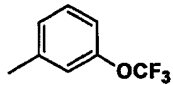
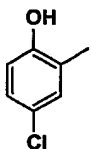
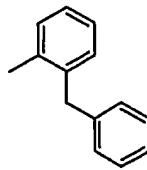
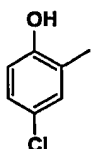
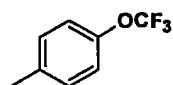
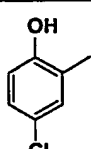
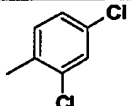
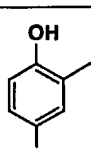
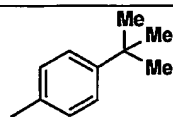
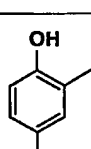
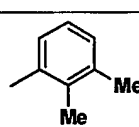
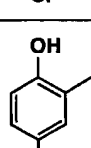
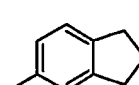
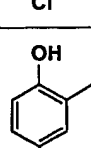
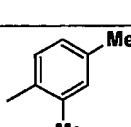
3 9 4		
3 9 5		
3 9 6		
3 9 7		
3 9 8		
3 9 9		
4 0 0		
4 0 1		
4 0 2		

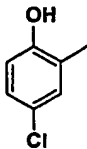
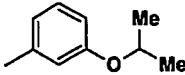
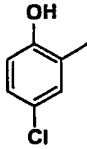
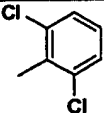
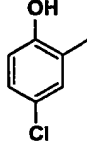
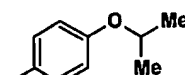
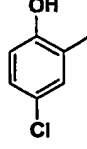
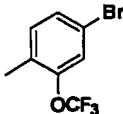
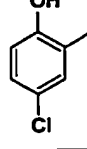
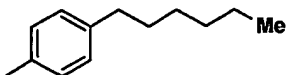
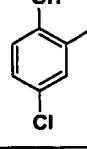
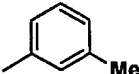
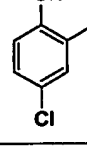
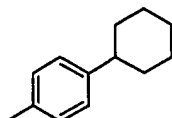
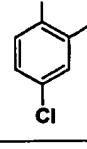
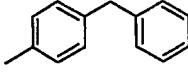
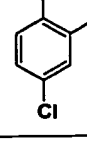
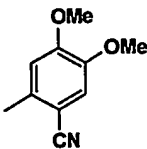
4 0 3		
4 0 4		
4 0 5		
4 0 6		
4 0 7		
4 0 8		
4 0 9		
4 1 0		
4 1 1		

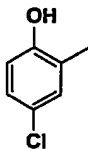
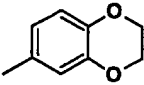
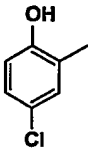
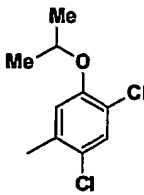
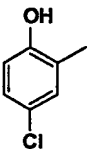
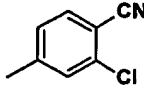
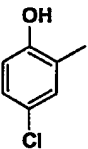
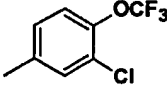
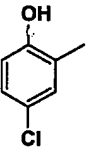
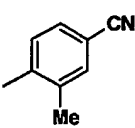
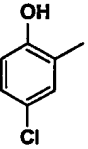
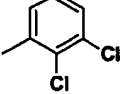
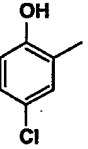
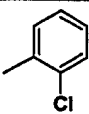
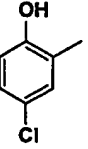
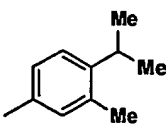
4 1 2		
4 1 3		
4 1 4		
4 1 5		
4 1 6		
4 1 7		
4 1 8		
4 1 9		

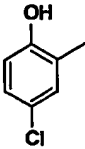
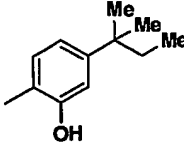
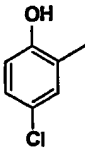
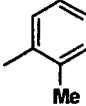
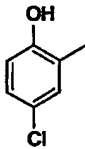
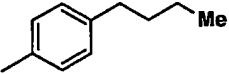
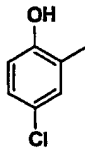
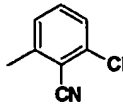
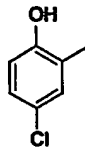
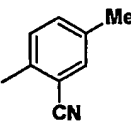
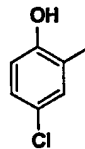
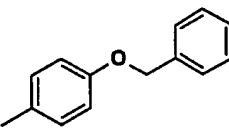
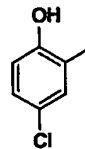
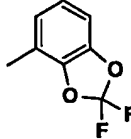
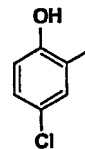
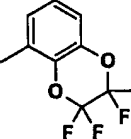
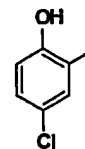
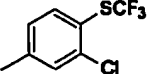


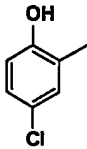
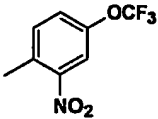
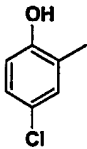
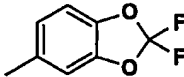
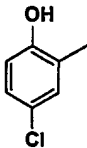
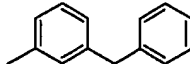
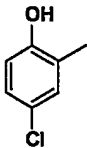
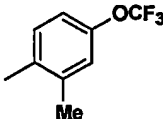
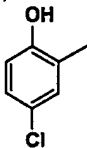
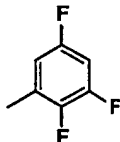
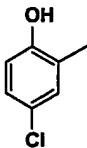
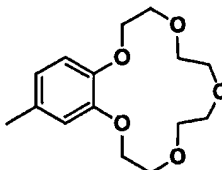
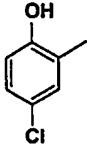
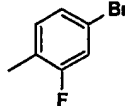
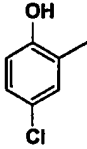
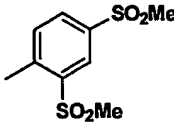
4 2 0		
4 2 1		
4 2 2		
4 2 3		
4 2 4		
4 2 5		
4 2 6		
4 2 7		
4 2 8		

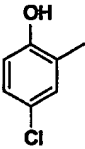
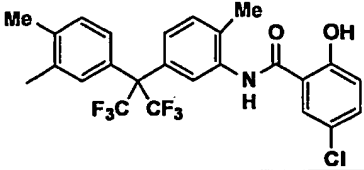
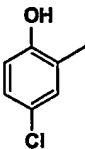
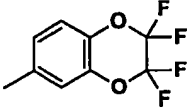
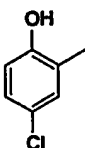
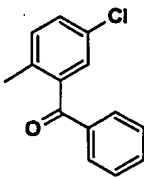
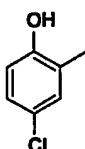
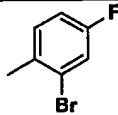
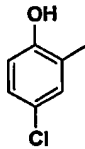
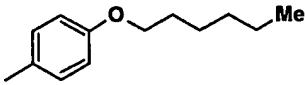
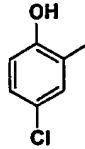
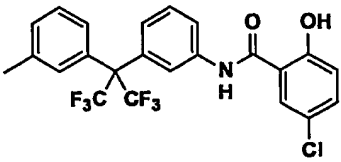
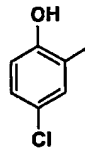
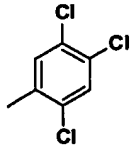
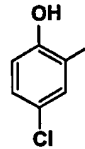
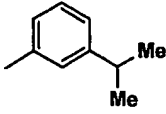
4 2 9		
4 3 0		
4 3 1		
4 3 2		
4 3 4		
4 3 4		
4 3 5		
4 3 6		

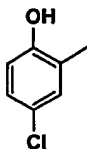
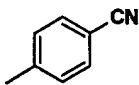
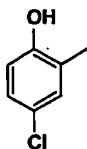
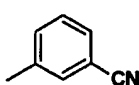
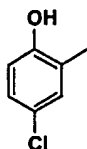
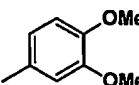
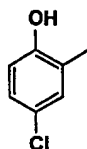
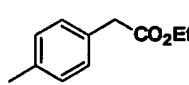
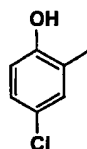
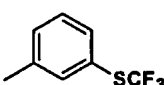
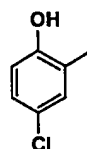
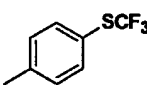
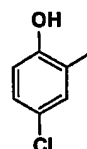
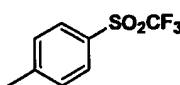
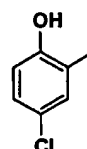
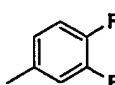
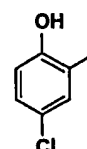
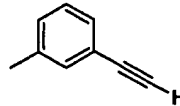
4 3 7		
4 3 8		
4 3 9		
4 4 0		
4 4 1		
4 4 2		
4 4 3		
4 4 4		
4 4 5		

4 4 6		
4 4 7		
4 4 8		
4 4 9		
4 5 0		
4 5 1		
4 5 2		
4 5 3		

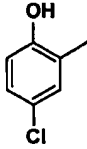
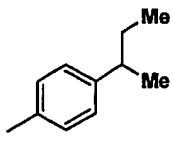
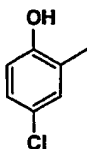
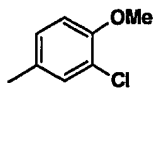
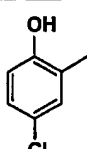
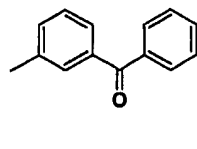
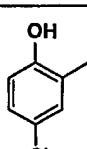
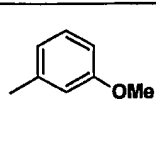
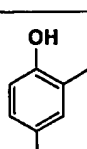
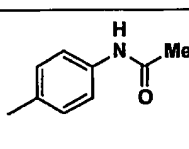
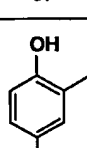
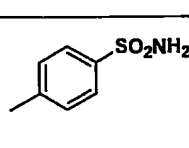
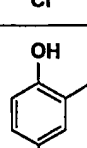
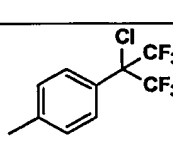
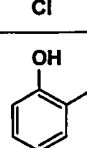
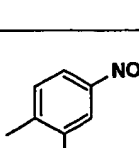
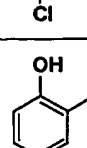
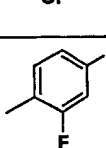
4 5 4		
4 5 5		
4 5 6		
4 5 7		
4 5 8		
4 5 9		
4 6 0		
4 6 1		
4 6 2		

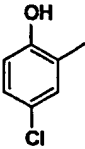
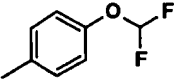
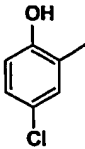
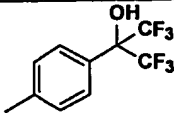
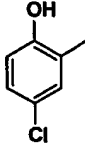
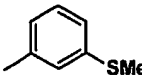
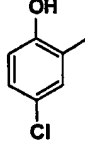
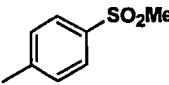
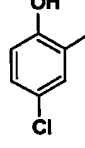
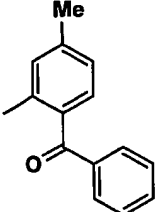
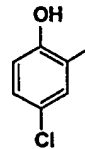
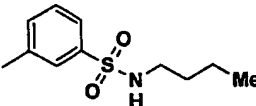
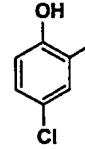
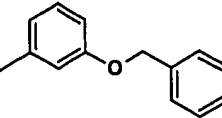
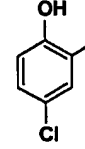
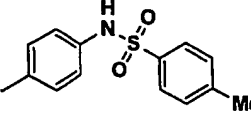
4 6 3		
4 6 4		
4 6 5		
4 6 6		
4 6 7		
4 6 8		
4 6 9		
4 7 0		

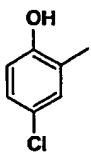
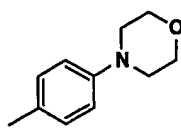
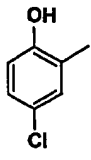
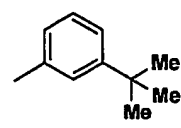
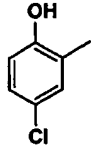
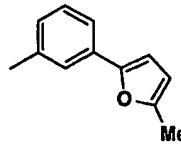
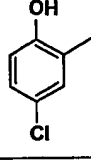
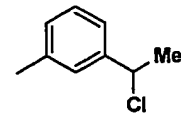
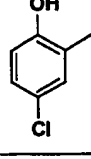
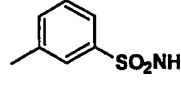
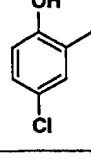
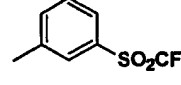
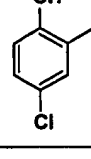
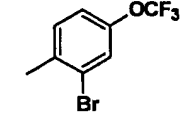
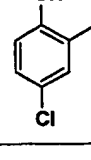
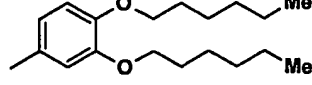
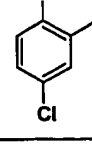
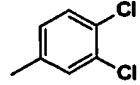
4 7 1		
4 7 2		
4 7 3		
4 7 4		
4 7 5		
4 7 6		
4 7 7		
4 7 8		

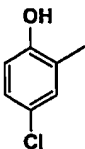
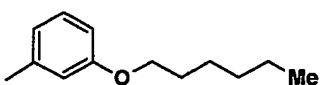
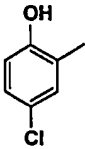
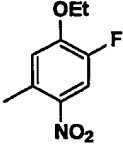
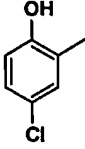
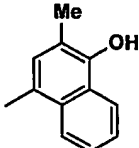
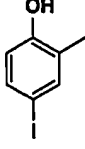
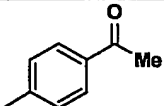
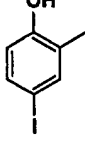
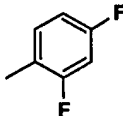
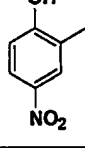
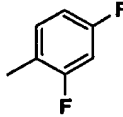
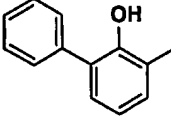
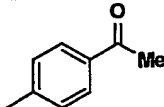
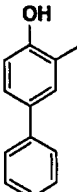
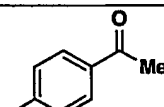
4 7 9		
4 8 0		
4 8 1		
4 8 2		
4 8 3		
4 8 4		
4 8 5		
4 8 6		
4 8 7		

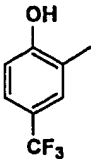
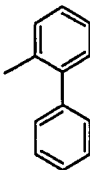
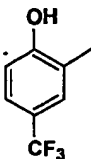
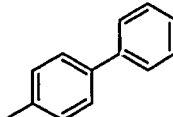
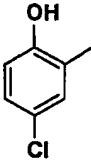
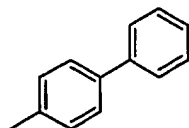
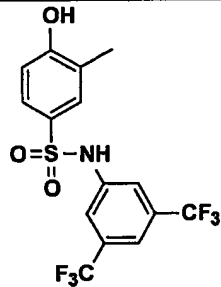
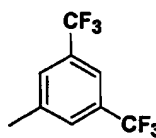
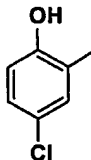
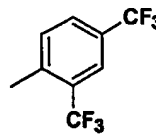
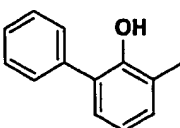
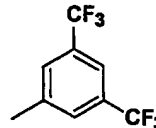
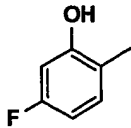
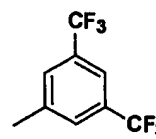
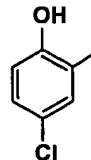
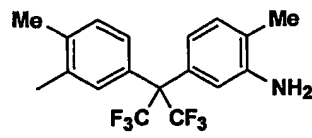


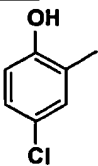
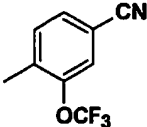
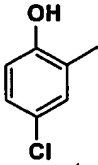
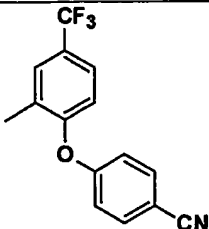
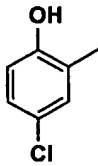
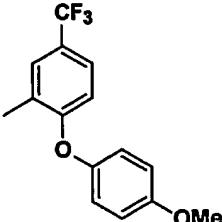
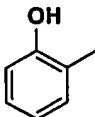
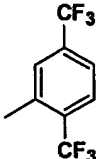
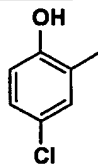
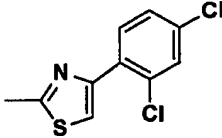
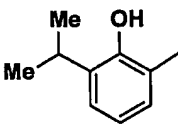
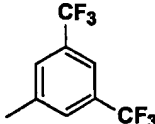
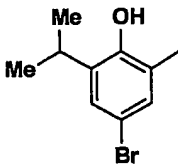
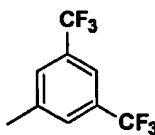
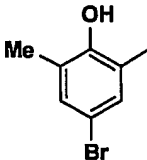
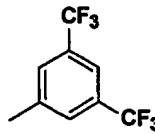
4 8 8		
4 8 9		
4 9 0		
4 9 1		
4 9 2		
4 9 3		
4 9 4		
4 9 5		
4 9 6		

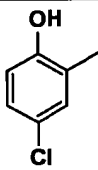
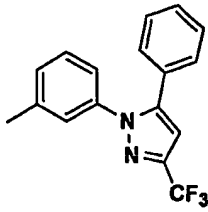
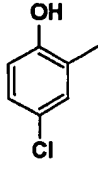
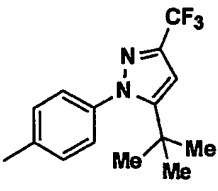
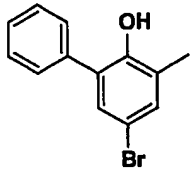
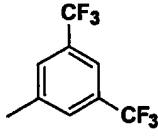
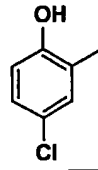
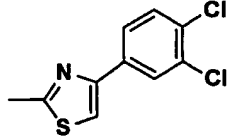
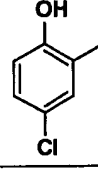
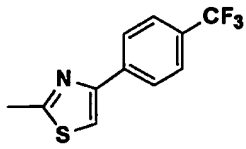
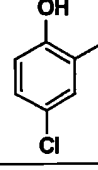
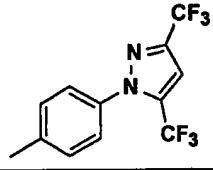
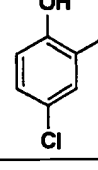
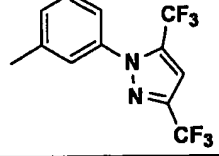
4 9 7		
4 9 8		
4 9 9		
5 0 0		
5 0 1		
5 0 2		
5 0 3		
5 0 4		

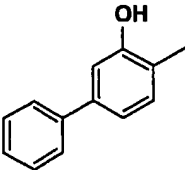
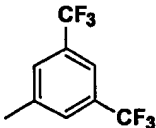
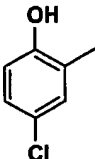

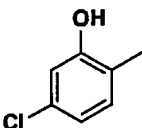
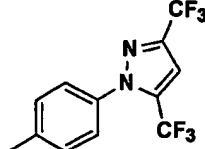
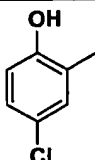
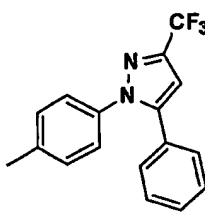
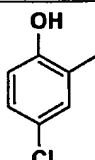
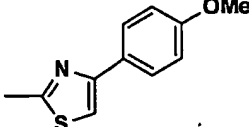
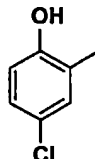
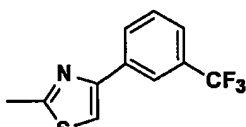
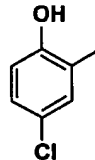
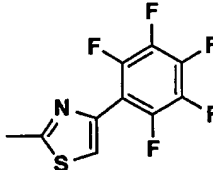
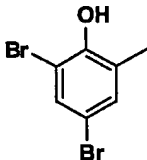
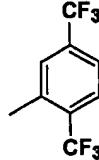
5 0 5		
5 0 6		
5 0 7		
5 0 8		
5 0 9		
5 1 0		
5 1 1		
5 1 2		
5 1 3		

5 1 4		
5 1 5		
5 1 6		
5 1 7		
5 1 8		
5 1 9		
5 2 0		
5 2 1		

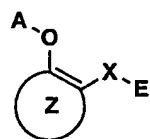
5 2 2		
5 2 3		
5 2 4		
5 2 5		
5 2 6		
5 2 7		
5 2 8		
5 2 9		

5 3 0		
5 3 1		
5 3 2		
5 3 3		
5 3 4		
5 3 5		
5 3 6		
5 3 7		

5 3 8		
5 3 9		
5 4 0		
5 4 1		
5 4 2		
5 4 3		
5 4 4		

5 4 5		
5 4 6		
5 4 7		
5 4 8		
5 4 9		
5 5 0		
5 5 1		
5 5 2		





化合物番号		X	E
5 5 3			
5 5 4			
5 5 5			

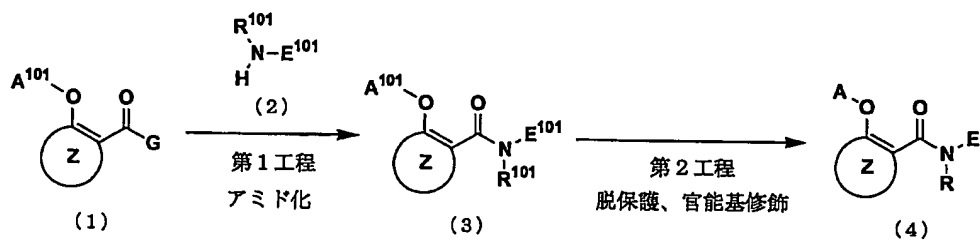
一般式 (I) で表される化合物の製造方法は特に限定されないが、例えば、「国際公開第 02/49632 号パンフレット」に記載された方法を参照することは有用である。

一般式 (I) で表される化合物は、例えば、以下に示した方法によって製造することができる。

#### <方法 1>

一般式 (I) において、X が  $-\text{CONH}-$  (窒素上の水素原子は置換されていてよい) で表される化合物は、例えば、反応工程式 1 に示す方法によって製造することができる。

#### 反応工程式 1



(式中、A、環 Z 及び E は、一般式 (I) における定義と同意義であり、A<sup>101</sup> は水素原子又はヒドロキシ基の保護基 (好ましくは、メチル基等のアルキル基；ベンジル基等のアラルキル基；アセチル基；メトキシメチル基等のアルコキシアルキル基；トリメチルシリル基等の置換シリル基) を表し、R 及び R<sup>101</sup> は水素原子、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub> のアルキル基等を表し、E<sup>101</sup> は、一般式 (I) の定義における E 又は E の前駆体を表し、G はヒドロキシ基、ハロゲン原子 (好ましくは、塩素原子)、炭化水素-オキシ基 (好ましくは、ハロゲン原子で置換されていてよいアリールーオキシ基)、アシル-オキシ基、イミド-オキシ基等を表す)

#### (第 1 工程)

カルボン酸誘導体 (1) とアミン (2) とを脱水縮合させることにより、アミド (3) 製造することができる。この反応は、酸ハロゲン化剤又は脱水縮合剤の存在下、塩基の存在又は非存在下、無溶媒又は非プロトン性溶媒中 0℃~180℃ の反応温度で行われる。

この反応は、酸ハロゲン化剤又は脱水縮合剤の存在下、塩基の存在又は非存在下、無溶媒又は非プロトン性溶媒中 0℃～180℃の反応温度で行われる。

酸ハロゲン化剤としては、例えば、塩化チオニル、臭化チオニル、塩化スルフリル、オキシ塩化リン、三塩化リン、五塩化リンなどを挙げることができ、 $A^{101}$ が水素原子の場合には三塩化リンが、 $A^{101}$ がアセチル基等の場合にはオキシ塩化リンが好ましい。脱水縮合剤としては、例えば、N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジドなどを挙げることができる。塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、あるいはピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。非プロトン性溶媒としてはジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、o-ジクロロベンゼン、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドンなどを挙げることができ、酸ハロゲン化剤の存在下に反応を行う場合には、特に、トルエン、モノクロロベンゼン、o-ジクロロベンゼンが好ましい。

また、例えば、「ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー (Journal of Medicinal Chemistry)」, (米国), 1998年, 第41巻, 第16号, p. 2939-2945に記載の方法及びこれらに準じた方法により、予めカルボン酸から酸塩化物を製造、単離し、次いで $E^{101}$ を有するアミンと反応させることにより目的とするアミドを製造することもできる。

Gがヒドロキシ基である場合の好適な反応条件として、例えば、「アーキブ・デア・ファルマツィー (Archiv der Pharmazie)」, (ドイツ), 1998年, 第331巻, 第1号, p. 3-6. に記載された反応条件を用いることができる。

カルボン酸誘導体(1)及びアミン(2)の種類は特に限定されず、文献公知の製造方法を適宜参照しつつ新規に合成するか、あるいは市販の試薬を入手して上記反応に用いることができる。

## (第2工程)

アミド(3)が保護基を有する場合及び／又は官能基修飾に有利な置換基(例えば、アミノ基及びその保護体若しくは前駆体；カルボキシ基及びその保護体若しくは前駆体；ヒドロキシ基及びその保護体若しくは前駆体など)を有する場合、この工程で脱保護反応及び／又は官能基修飾反応を行うことにより最終目的物である化合物(4)を製造することができる。該反応は、種々の公知の方法を用いることができ、脱保護反応及び官能基修飾反応としては、例えば、セオドラ・W・グリーン(Theodora W. Green), ピーター・G・M・ブツツ(Peter G. M. Wuts) 編「プロテクティブ・グループス・イン・オーガニック・シンセシズ(Protective Groups in Organic Syntheses)」, (米国), 第3版, ジョン・ウィリー・アンド・サンズ・インク(John Wiley & Sons, Inc.), 1999年4月；「ハンドブック・オブ・リエージェンツ・フォー・オーガニック・シンセシス(Handbook of Reagents for Organic Synthesis)」, (米国), 全4巻, ジョン・ウィリー・アンド・サンズ・インク(John Wiley & Sons, Inc.), 1999年6月, 等に記載の方法を；官能基修飾反応としては、例えばリチャード・F・ヘック(Richard F. Heck) 著「パラジウム・リエージェンツ・イン・オーガニック・シンセシス(Palladium Reagents in Organic Syntheses)」, (米国), アカデミック・プレス(Academic Press), 1985年；辻二郎(J. Tsuji) 著「パラジウム・リエージェンツ・アンド・カタリスト：イノベーションズ・イン・オーガニック・シンセシス(Palladium Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis)」, (米国), ジョン・ウィリー・アンド・サンズ・インク(John Wiley & Sons, Inc.), 1999年, 等に記載の方法を用いることができる。

上記方法は、Xが他の連結基(例えば、 $-\text{SO}_2\text{NH}-$ 、 $-\text{NHCO}-$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CONHCH}_2-$ 、 $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CONHCH}_2\text{CONH}-$ 、 $-\text{CONHNHCO}-$ 、 $-\text{CONHNHCH}_2-$ 、 $-\text{COO}-$ 、 $-\text{CONHNH}-$ ；該連結基上の水素原子は置換されていてもよい)である場合においても、原料を適切に組み合わせることによって適用可能である。

一般式 (I) において、X が式： $-\text{CONHCH}_2-$ （該基上の水素原子は置換されていてもよい）である場合、アミン (2) のかわりに式： $\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{E}^{101}$ （式中、 $\text{E}^{101}$  は上記定義と同義である）で表されるアミンを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式： $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2-$ （該基上の水素原子は置換されていてもよい）である場合、アミン (2) のかわりに式： $\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{E}^{101}$ （式中、 $-\text{E}^{101}$  は上記定義と同義である）で表されるアミンを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式： $-\text{SO}_2\text{NH}-$ である場合、カルボン酸誘導体 (1) のかわりに式： $\text{A}^{101}-\text{O}-$ （環 Z） $-\text{SO}_2\text{Cl}$ （式中、 $\text{A}^{101}$  及び環 Z は上記定義と同義である）で表されるスルホン酸クロリドを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式： $-\text{NHCO}-$ である場合、式： $\text{A}^{101}-\text{O}-$ （環 Z） $-\text{NH}_2$ （式中、 $\text{A}^{101}$  及び環 Z は上記定義と同義である）で表されるアミンと、式： $\text{E}^{101}-\text{COOH}$ （式中、 $-\text{E}^{101}$  は上記定義と同義である）で表されるカルボン酸若しくは式： $\text{E}^{101}-\text{COCl}$ （式中、 $-\text{E}^{101}$  は上記定義と同義である）で表されるカルボン酸クロリドを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式： $-\text{NH}\text{SO}_2-$ （該連結基は置換基を有していてもよい）である場合、式： $\text{HO}-$ （環 Z） $-\text{NH}_2$ （式中、環 Z は上記定義と同義である）で表されるアミンと式： $\text{E}^{101}-\text{SO}_2\text{Cl}$ （式中、 $\text{E}^{101}$  は上記定義と同義である）で表されるスルホン酸クロリドを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式： $-\text{CONHNHCO}-$ である場合、式： $\text{HO}-$ （環 Z） $-\text{CONHNH}_2$ （式中、環 Z は上記定義と同義である）で表されるヒドラジドと式： $\text{E}^{101}-\text{COCl}$ （式中、 $-\text{E}^{101}$  は上記定義と同義である）で表されるカルボン酸クロリドを用いることにより、目的とする化合物を製造するこ

とができる。

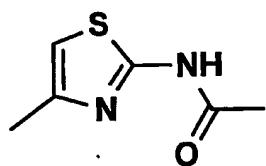
一般式 (I) において、X が式：—COO—である場合、アミン (2) のかわりに式：HO—E<sup>101</sup> (式中、E<sup>101</sup> は上記定義と同義である) で表されるフェノール誘導体を用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式：—CONHNH—である場合、アミン (2) のかわりに式：H<sub>2</sub>N—NH—E<sup>101</sup> (式中、E<sup>101</sup> は上記定義と同義である) で表されるヒドラジンを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

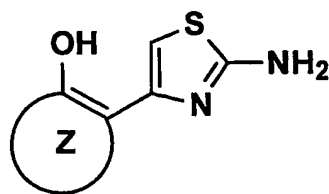
一般式 (I) において、X が式：—CONHCH<sub>2</sub>CONH— (該連結基は置換基を有していてもよい) である場合、アミン (2) のかわりに式：H<sub>2</sub>N—CH<sub>2</sub>CONH—E<sup>101</sup> (式中、E<sup>101</sup> は上記定義と同義である) で表されるアミンを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

ここで、式：H<sub>2</sub>N—CH<sub>2</sub>CONH—E<sup>101</sup> で表されるアミンは、例えば、アミン (2) と N-保護アミノ酸 (具体例：N-(tert-ブトキシカルボニル) クリシン) を上記方法 1 に記載された方法で縮合した後、脱保護反応を行うことにより製造することができる。

一般式 (I) において、X が下記式：



(該連結基は置換基を有していてもよい) である場合、下記式：

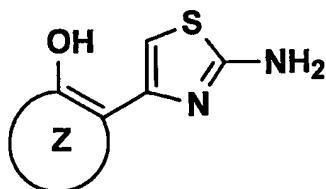


(式中、環 Z は上記定義と同義である)

で表されるアミン式と、式：E<sup>101</sup>—COOH (式中、E<sup>101</sup> は上記定義と同義である) で表されるカルボン酸若しくは式：E<sup>101</sup>—COCl (式中、E<sup>101</sup> は上記

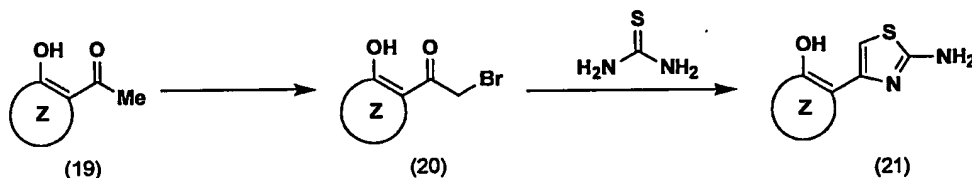
定義と同義である) で表されるカルボン酸クロリドを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

ここで、下記式：



で表されるアミンは、例えば、反応工程式 1 - 2 に示す方法によって製造することができる。

反応工程式 1 - 2



(式中、環 Z は上記定義と同義である)

アセトフェノン (19) をプロモ化することにより、プロモアセトフェノン (20) を製造することができる。

この反応は、プロモ化剤の存在下、溶媒中、0℃ないし100℃の反応温度で行われる。

プロモ化剤としては、例えば、フェニルトリメチルアンモニウムトリプロミドを好適に用いることができる。

反応溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればいかなるものでもよく、例えば、テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒を用いることができる。

次いでプロモアセトフェノン (20) とチオウレアを反応することによりアミン (21) を製造することができる。

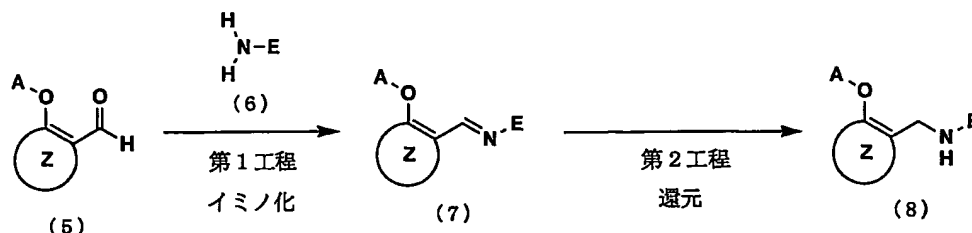
この反応は、溶媒中、0℃ないし120℃の反応温度で行われる。

反応溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればいかなるものでもよく、例えばエタノール等のアルコール系溶媒を用いることができる。

## &lt;方法2&gt;

一般式 (I) において、X が  $-\text{CH}_2\text{NH}-$  で表される化合物は、例えば、反応工程式 2 に示す方法によって製造することができる。

## 反応工程式 2



(式中、A、環 Z 及び E は、一般式 (I) における定義と同意義である)

まず、アルデヒド (5) とアミン (6) とを脱水縮合させることにより、式 (7) のイミン誘導体を製造することができる。この反応は、脱水剤の存在下又は非存在下において、溶媒中で  $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$  の反応温度で行われる。脱水剤としては無水硫酸マグネシウム、モレキュラーシーブなどを挙げることができる。溶媒としては非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、メタノール、エタノール等が好ましい。

上記方法は、X が他の連結基 (例えば、 $-\text{CONHN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{NNHCO}-$ 、 $-\text{CHNNH}-$ ; 該連結基上の水素原子は置換されていてもよい) である場合においても、原料を適切に組み合わせることによって適用可能である。

一般式 (I) において、X が式:  $-\text{CONHN}=\text{CH}-$  である場合、式:  $\text{HO}-$  (環 Z)  $-\text{CONHNH}_2$  (式中、環 Z は上記定義と同義である) で表されるヒドラジドと式:  $\text{E}-\text{CHO}$  (式中、E は上記定義と同義である) で表されるアルデヒドを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式:  $-\text{CH}=\text{NNHCO}-$  である場合、式:  $\text{HO}-$  (環 Z)  $-\text{CHO}$  (式中、環 Z は上記定義と同義である) で表されるアルデヒドと式:  $\text{E}-\text{CONHNH}_2$  (式中、E は上記定義と同義である) で表されるヒドラジドを用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

一般式 (I) において、X が式:  $-\text{CH}=\text{NNH}-$  である場合、式:  $\text{HO}-$  (環



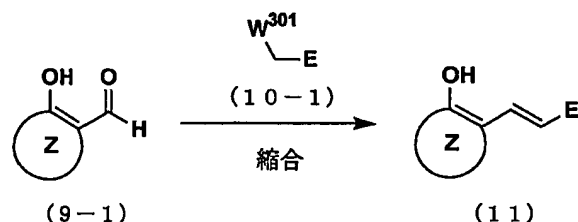
Z) -CHO (式中、環Zは上記定義と同義である) で表されるアルデヒドと式：  
E-NHNH<sub>2</sub> (式中、Eは上記定義と同義である) で表されるヒドラジンを  
用いることにより、目的とする化合物を製造することができる。

次いで、イミン誘導体 (7) を還元することにより目的化合物である (8) を製  
造することができる。この反応は、還元剤の存在下に溶媒中で0℃～100℃の  
反応温度で行われる。還元剤としては水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リ  
チウムなどを挙げる事ができる。溶媒としては非反応性の溶媒が挙げられるが、  
テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、メタノール、エタノール等が好ましい。  
またこの反応は、接触水素添加法によっても行われる。触媒としてはパラジウム  
炭素、白金炭素、水酸化パラジウム、パラジウムブラックなどを挙げる事がで  
きる。溶媒としては非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1,  
4-ジオキサン、メタノール、エタノール、水等が好ましい。反応は0℃～20  
0℃の反応温度、水素圧は常圧又は加圧下で行われる。

### <方法3>

一般式 (I) において、Xが-CH=CH- (該連結基上の水素原子は置換され  
ていてもよい) で表される化合物は、例えば、反応工程式3-1、又は反応工程  
式3-2に示す方法によって製造することができる。

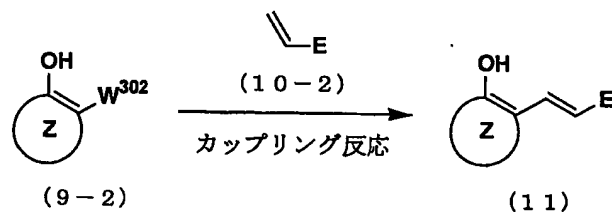
#### 反応工程式3-1



(式中、環Z及びEは、一般式 (I) における定義と同義であり、W<sup>301</sup>は、  
O, O'-ジ-炭化水素-ホスホノ基又はトリアリールホスホニウム基を表す)  
アルデヒド (9-1) とリン化合物 (10-1) とを脱水縮合させることにより、  
目的化合物である (11) を製造することができる。この反応は、塩基存在下、  
溶媒中で0℃～溶媒沸点の反応温度で行われる。塩基としては、炭酸ナトリウム、

炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、あるいはピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。溶媒としては、非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、メタノール、エタノール、水等が好ましい。

反応工程式 3-2



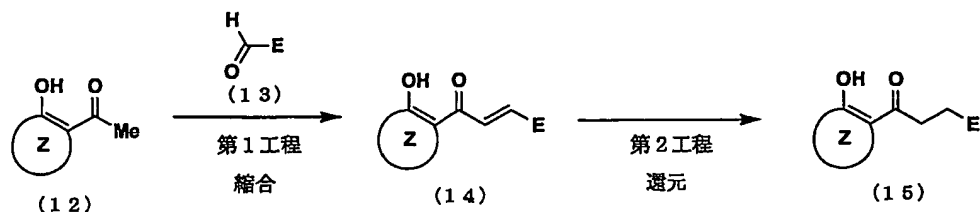
(式中、環 Z 及び E は、一般式 (I) における定義と同意義であり、W<sup>302</sup> は、ハロゲン原子 (好ましくは沃素原子、臭素原子)、(トリフルオロメタンスルホニル) オキシ基などを表す)

ハロゲン化物 (9-2) とスチレン誘導体 (10-2) とを遷移金属錯体触媒の存在下、カップリング反応させることにより、目的化合物である (11) を製造することができる。この反応は、遷移金属錯体触媒の存在下、配位子及び／又は塩基の存在又は非存在下、溶媒中で 0℃～溶媒沸点の反応温度で行われる。遷移金属錯体触媒としては、例えば、酢酸パラジウム、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム等のパラジウム系触媒が挙げられる。配位子としては、例えば、トリフェニルホスフィン等のホスフィン系配位子が挙げられる。塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、あるいはピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。溶媒としては、非反応性の溶媒が挙げられるが、N, N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等が好ましい。

#### <方法 4>

一般式 (I) において、X が -COCH=CH- 及び -COCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- (該連結基上の水素原子は置換されていてもよい) で表される化合物は、例えば、反応工程式 4 に示す方法によって製造することができる。

## 反応工程式 4



(式中、環 Z 及び E は、一般式 (I) における定義と同意義である)

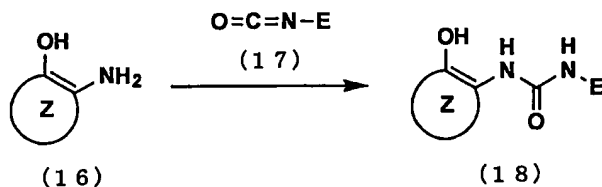
まず、ケトン (12) とアルデヒド (13) とを脱水縮合させることにより、目的化合物であるエノン (14) を製造することができる。この反応は、塩基の存在下、溶媒中で 0℃～溶媒沸点の反応温度で行われる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、あるいはピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、メタノール、エタノール、水等が好ましい。

次いで、エノン (14) を還元することにより目的化合物である (15) を製造することができる。この反応は、還元剤の存在下に溶媒中で 0℃～100℃の反応温度で行われる。還元剤としては水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムなどを挙げることができる。溶媒としては非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、メタノール、エタノール等が好ましい。またこの反応は、接触水素添加法によっても行われる。触媒としてはパラジウム炭素、白金炭素、水酸化パラジウム、パラジウムブラックなどを挙げることができる。溶媒としては非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、メタノール、エタノール、水等が好ましい。反応は 0℃～200℃の反応温度、水素圧は常圧又は加圧下で行われる。

## &lt;方法 5&gt;

一般式 (I) において、X が -NHCONH- (該連結基上の水素原子は置換されていてもよい) で表される化合物は、例えば、反応工程式 5 に示す方法によって製造することができる。

## 反応工程式 5



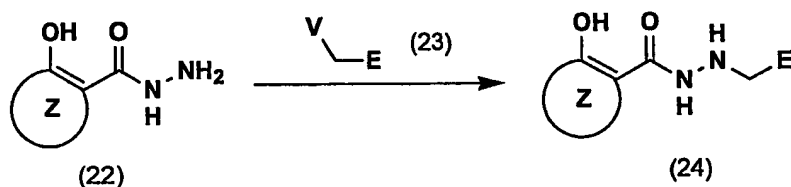
(式中、環 Z 及び E は、一般式 (I) における定義と同意義である)

まず、アミン (16) とイソシアネート (17) とを反応させることにより、目的化合物であるウレア (18) を製造することができる。この反応は、塩基の存在又は非存在下、溶媒中で 0℃～溶媒沸点の反応温度で行われる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、あるいはピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。非反応性の溶媒が挙げられるが、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、メタノール、エタノール、水等が好ましい。

## &lt;方法 6&gt;

一般式 (I) において、X が式： $-\text{CONHNHCH}_2-$  (該連結基は置換基を有していてもよい) で表される化合物は、例えば、反応工程式 6 に示す方法によって製造することができる。

## 反応工程式 6



(式中、環 Z 及び E は上記定義と同義であり、V はハロゲン原子等の脱離基を表す)

ヒドラジド (22) とベンジル誘導体 (23) を反応させることにより、目的とするヒドラジド (24) を製造することができる。

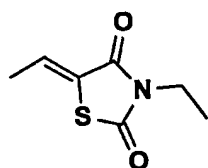
この反応は、塩基の存在又は非存在下、溶媒中、0℃ないし 180℃の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基を好適に用いることができる。

反応溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればいかなるものでもよく、例えば、ジクロロメタン等のハロゲン系溶媒；テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒；トルエン等の炭化水素系溶媒を用いることができる。

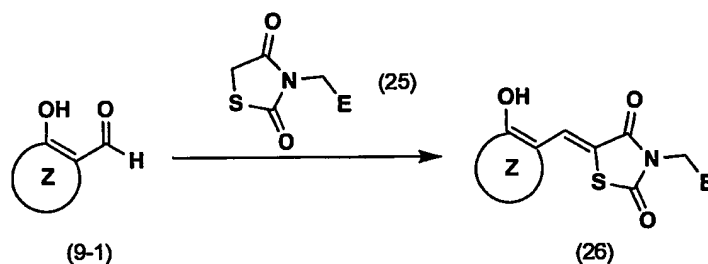
#### <方法 7>

一般式 (I) において、X が式：



で表される化合物は、例えば、反応工程式 7 に示す方法によって製造することができる。

#### 反応工程式 7



(式中、環 Z 及び E は上記定義と同義である)

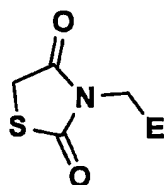
アルデヒド (9-1) と 3-ベンジルチアゾリジン-2, 4-ジオン誘導体 (25) を反応させることにより、目的とする 5-(ベンジリデン)-3-ベンジルチアゾリジン-2, 4-ジオン誘導体 (26) を製造することができる。

この反応は、触媒の存在下、溶媒中、0℃ないし 180℃の反応温度で行われる。

触媒としては、例えば、ピペリジン／酢酸の混合物を好適に用いることができる。

反応溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればいかなるものでもよく、例えば、トルエン等の炭化水素系溶媒を用いることができる。

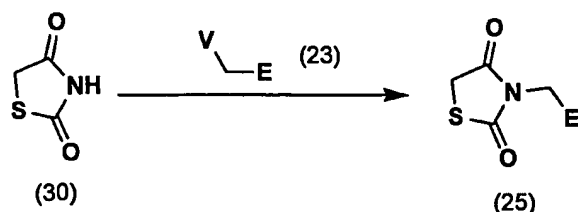
ここで、下記式：



(式中、Eは上記定義と同義である)

で表される3-ベンジルチアゾリジン-2,4-ジオン誘導体は、例えば、反応工程式7-1に示す方法によって製造することができる。

反応工程式7-1



(式中、E及びVは上記定義と同義である)

チアゾリジン-2,4-ジオン(30)とベンジル誘導体(23)を反応させることにより、目的とする3-ベンジルチアゾリジン-2,4-ジオン誘導体(28)を製造することができる。

この反応は、塩基の存在下、溶媒中、0℃ないし180℃の反応温度で行われる。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基を好適に用いることができる。

反応溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればいかなるものでもよく、例えば、水；エタノール等のアルコール系溶媒；ジクロロメタン等のハロゲン系溶媒；テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒；N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒を用いることができる。

以上のような方法で製造された一般式(I)で表される化合物は、当業者に周知の方法、例えば、抽出、沈殿、分画クロマトグラフィー、分別結晶化、懸濁洗浄、再結晶などにより、単離、精製することができる。また、本発明化合物の薬理的に許容される塩、並びにそれらの水和物及び溶媒和物も、それぞれ当業者に周

知の方法で製造することができる。

本明細書の実施例には、一般式（I）に包含される代表的化合物の製造方法が具体的に説明されている。従って、当業者は、上記の一般的な製造方法の説明及び実施例の具体的製造方法の説明を参照しつつ、適宜の反応原料、反応試薬、反応条件を選択し、必要に応じてこれらの方法に適宜の修飾ないし改変を加えることによって、一般式（I）に包含される化合物をいずれも製造可能である。

一般式（I）で示される化合物はインスリン抵抗性改善作用、高インスリン血症改善作用、及び高血糖改善作用を有しており、糖尿病又は糖尿病の合併症の予防及び／又は治療のための医薬の有効成分として用いることができる。本明細書において、糖尿病の合併症とは高血糖及び／又は高インスリン血症に起因する疾患を含む概念であり、例えば、腎症、網膜症、白内障、神経症、壊疽などの典型的な糖尿病の合併症のほか、高血糖による昏睡、動脈硬化、高脂血症、肥満を含めて最も広義に解釈する必要がある。

本発明の医薬の有効成分としては、一般式（I）で表される化合物及び薬理学的に許容されるそれらの塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質の1種又は2種以上を用いることができる。本発明の医薬としては上記の物質自体を用いてもよいが、好適には、本発明の医薬は有効成分である上記の物質と1又は2以上の薬学的に許容される製剤用添加物とを含む医薬組成物の形態で提供される。上記医薬組成物において、製剤用添加物に対する有効成分の割合は、1重量%から90重量%程度である。

本発明の医薬は、例えば、顆粒剤、細粒剤、散剤、硬カプセル剤、軟カプセル剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤、又は液剤などの経口投与用の医薬組成物として投与してもよいし、静脈内投与、筋肉内投与、若しくは皮下投与用の注射剤、点滴剤、坐剤、経皮吸収剤、経粘膜吸収剤、点鼻剤、点耳剤、点眼剤、吸入剤などの非経口投与用の医薬組成物として投与することもできる。粉末の形態の医薬組成物として調製された製剤を用時に溶解して注射剤又は点滴剤として使用してもよい。医薬用組成物の製造には、固体又は液体の製剤用添加物を用いることができる。

製剤用添加物は有機又は無機のいずれであってもよい。すなわち、経口用固形製剤を製造する場合は、主薬に賦形剤、さらに必要に応じて結合剤、崩壊剤、滑沢剤、着色剤、矯味矯臭剤などを加えた後、常法により錠剤、被覆錠剤、顆粒剤、散剤、カプセル剤などの形態の製剤を調製することができる。用いられる賦形剤としては、例えば、乳糖、蔗糖、白糖、ブドウ糖、コーンスターチ、デンプン、タルク、ソルビット、結晶セルロース、デキストリン、カオリン、炭酸カルシウム、二酸化ケイ素などを挙げることができる。結合剤としては、例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニルエーテル、エチルセルロース、メチルセルロース、アラビアゴム、トラガント、ゼラチン、シェラック、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、クエン酸カルシウム、デキストリン、ペクチンなどを挙げることができる。滑沢剤としては、例えば、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ポリエチレングリコール、シリカ、硬化直植物油などを挙げることができる。着色剤としては、通常医薬品に添加することが許可されているものであればいずれも使用することができる。矯味矯臭剤としては、ココア末、ハッカ脳、芳香酸、ハッカ油、龍脳、桂皮末などを使用することができる。これらの錠剤、顆粒剤には、糖衣、ゼラチン衣、その他必要により適宜コーティングを付することができる。また、必要に応じて、防腐剤、抗酸化剤等を添加することができる。

経口投与のための液体製剤、例えば、乳剤、シロップ剤、懸濁剤、液剤の製造には、一般的に用いられる不活性な希釈剤、例えば水又は植物油を用いることができる。この製剤には、不活性な希釈剤以外に、補助剤、例えば湿潤剤、懸濁補助剤、甘味剤、芳香剤、着色剤又は保存剤を配合することができる。液体製剤を調製した後、ゼラチンのような吸収されうる物質のカプセル中に充填してもよい。非経口投与用の製剤、例えば注射剤又は坐剤等の製造に用いられる溶剤又は懸濁剤としては、例えば、水、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ペンジルアルコール、オレイン酸エチル、レシチンを挙げることができる。坐剤の製造に用いられる基剤としては、例えば、カカオ脂、乳化カカオ脂、ラウリン脂、



ウィテップゾールを挙げることができる。製剤の調製方法は特に限定されず、当業界で汎用されている方法はいずれも利用可能である。

注射剤の形態にする場合には、担体として、例えば、水、エチルアルコール、マクロゴール、プロピレングリコール、クエン酸、酢酸、リン酸、乳酸、乳酸ナトリウム、硫酸及び水酸化ナトリウム等の希釈剤；クエン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム及びリン酸ナトリウム等のpH調整剤及び緩衝剤；ピロ亜硫酸ナトリウム、エチレンジアミン四酢酸、チオグリコール酸及びチオ乳酸等の安定化剤等が使用できる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するために十分な量の食塩、ブドウ糖、マンニトール又はグリセリンを製剤中に配合してもよく、通常の溶解補助剤、無痛化剤又は局所麻酔剤等を使用することもできる。

軟膏剤、例えば、ペースト、クリーム及びゲルの形態にする場合には、通常使用される基剤、安定剤、湿潤剤及び保存剤等を必要に応じて配合することができ、常法により成分を混合して製剤化することができる。基剤としては、例えば、白色ワセリン、ポリエチレン、パラフィン、グリセリン、セルロース誘導体、ポリエチレングリコール、シリコン及びベントナイト等を使用することができる。保存剤としては、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸エチル、パラオキシ安息香酸プロピル等を使用することができる。貼付剤の形態にする場合には、通常の支持体に上記軟膏、クリーム、ゲル又はペースト等を常法により塗布することができる。支持体としては、綿、スフ及び化学繊維からなる織布又は不織布；軟質塩化ビニル、ポリエチレン及びポリウレタン等のフィルム又は発泡体シートを好適に使用できる。

本発明の医薬の投与量は特に限定されないが、経口投与の場合には、成人一日あたり有効成分である上記物質の重量として通常0.01～5,000mgである。この投与量を患者の年齢、病態、症状に応じて適宜増減することが好ましい。前記一日量は一日に一回、又は適当な間隔をおいて一日に2～3回に分けて投与してもよいし、数日おきに間歇投与してもよい。注射剤として用いる場合には、成人一日あたり有効成分である上記物質の重量として0.001～100mg程度

である。

### 実施例

以下、実施例により本発明をさらに具体的に説明するが、本発明の範囲は下記の実施例に限定されることはない。実施例中、化合物番号は上記の表において示した化合物の番号と対応させてある。また、本実施例中には、市販の試薬を購入しそのまま試験に供した化合物が含まれる。そのような化合物については、試薬の販売元及びカタログに記載されているコード番号を示す。

#### 例 1：化合物番号 1 の化合物の製造

アルゴン雰囲気下、5-ブロモサリチル酸 (217 mg, 1 mmol)、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) ベンジルアミン (243 mg, 1 mmol)、4-ジメチルアミノピリジン (12 mg, 0.1 mmol)、テトラヒドロフラン (10 ml) の混合物に 1- (3-ジメチルアミノプロピル) -3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (以下、WSC・HCl と略す; 192 mg, 1 mmol) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧留去して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 4 : 1) で精製して標題化合物の白色固体 (244.8 mg, 55.4%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ ):  $\delta$  4.69 (2H, d,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 6.93 (1H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.56 (1H, dd,  $J=8.7, 2.4\text{ Hz}$ ), 8.02 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 8.06 (3H, s), 9.41 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 12.13 (1H, s).

#### 例 2：化合物番号 2 の化合物の製造

(1) 2-アセトキシ-N- (2-フェネチル) ベンズアミド

O-アセチルサリチル酸クロリド (0.20 g, 1.00 mmol) をベンゼン (8 mL) に溶かし、フェネチルアミン (0.12 g, 1.00 mmol)、ピリ

ジン (0.3 mL) を加え、室温で2時間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧留去して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1→1:1) で精製して標題化合物の白色結晶 (155.5 mg, 54.9%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.09 (3H, s), 2.92 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 3.71 (2H, q,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 6.32 (1H, br s), 7.07 (1H, dd,  $J=8.4, 1.2\text{ Hz}$ ), 7.23–7.35 (6H, m), 7.44 (1H, ddd,  $J=8.0, 7.6, 1.6\text{ Hz}$ ), 7.73 (1H, dd,  $J=7.6, 1.6\text{ Hz}$ ).

以下の実施例において例2(1)の製造法が引用されている場合、塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基を用いた。また、反応溶媒としては、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ベンゼン等の溶媒を単独若しくは混合して用いた。

(2) 2-ヒドロキシー-N-(2-フェネチル) ベンズアミド

2-アセトキシー-N-(2-フェネチル) ベンズアミド (155.5 mg) にメタノール (5 mL)、2規定水酸化ナトリウム (0.1 mL) を加え、室温で30分間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧留去して得られた残渣を結晶化 (ジクロロメタン/ヘキサン) して標題化合物の白色固体 (106.9 mg, 80.7%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  2.86 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.52 (1H, q,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 6.84–6.88 (2H, m), 7.18–7.31 (5H, m), 7.37 (1H, ddd,  $J=8.4, 7.2, 1.6\text{ Hz}$ ), 7.80 (1H, dd,  $J=8.4, 1.6\text{ Hz}$ ), 8.84 (1H, s), 12.51 (1H, s).

以下の実施例において例2(2)の方法が引用されている場合、塩基としては、

水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基を用いた。また、反応溶媒としては、水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン等の溶媒を単独若しくは混合して用いた。

(3) 5-ブロモ-2-ヒドロキシ-N-(2-フェネチル)ベンズアミド (化合物番号2)

2-ヒドロキシ-N-(2-フェネチル)ベンズアミド (79.6 mg, 0.33 mmol) に四塩化炭素 (5 mL)、鉄粉 (0.03 g)、臭素 (25  $\mu$ l, 0.48 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物を亜硫酸水素ナトリウム水溶液にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧留去して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1) で精製して標題化合物の白色粉末 (62 mg, 58.7%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ ):  $\delta$  2.85 (2H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.52 (1H, q,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 6.87 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.18-7.31 (5H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=8.8, 2.4\text{ Hz}$ ), 8.01 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 8.90 (1H, s), 12.51 (1H, s).

例3: 化合物番号3の化合物の製造

5-ブロモサリチル酸 (109 mg, 0.5 mmol)、2-アミノ-5-(モルホリノ)カルボニルインダン (141 mg, 0.5 mmol)、トリエチルアミン (70  $\mu$ L, 0.5 mmol) のジクロロメタン (5 mL) 溶液に、WSC $\cdot$ HCl (96 mg, 0.5 mmol) を添加し、40 $^{\circ}\text{C}$ で1.5時間加熱攪拌した。冷却後、酢酸エチルで希釈し、2規定塩酸、水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=19:1) で精製し、標題化合物の白色結晶 (26 mg, 11.9%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ ):  $\delta$  2.66 (1H, dd,  $J=16.2, 7.2$

H z), 2. 8 2 (1 H, d d, J = 1 6. 2, 7. 2 H z), 3. 1 6 - 3. 2 5 (2 H, m), 3. 4 3 - 3. 8 6 (8 H, m), 4. 7 9 - 4. 9 2 (1 H, m), 6. 8 8 (1 H, d, J = 8. 7 H z), 7. 1 4 - 7. 1 5 (3 H, m), 7. 4 6 (1 H, d d, J = 8. 7, 2. 4 H z), 7. 7 4 (1 H, d, J = 7. 8 H z), 7. 8 4 (1 H, d, J = 2. 4 H z).

[2-アミノ-5-(モルホリノ)カルボニルインダン:「ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ビュレティン(Chemical and Pharmaceutical Bulletin)」, 2000年, 第48巻, p. 131参照]

例4: 化合物番号4の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元: A p i n C h e m i c a l s 社

カタログコード番号: N 0 1 0 0 D

例5: 化合物番号5の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元: S p e c s 社

カタログコード番号: A I - 2 3 3 / 3 1 5 8 1 0 2 4

例6: 化合物番号6の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元: M a y b r i d g e 社

カタログコード番号: R J C 0 0 1 0 6

例7: 化合物番号7の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元: M a y b r i d g e 社

カタログコード番号: B T B 1 3 2 3 0

例8: 化合物番号8の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元: M a y b r i d g e 社

カタログコード番号：B T B 1 1 4 4 8 2

例 9：化合物番号 9 の化合物の製造

5-クロロサリチルアルデヒド (313 mg, 2 mmol)、4-クロロベンジルトリフェニルフォスホニウムクロリド (847 mg, 2 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (20 mL) に溶解し、炭酸カリウム (1.382 g, 10 mmol) を水 (10 mL) に溶かして加え、5 時間加熱還流した。冷却後、反応混合物を 2 規定塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧留去して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 1) で精製して標題化合物の灰白色固体 (44.6 mg, 8.4%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  5.04 (1H, s), 6.74 (1H, d,  $J = 9.0 \text{ Hz}$ ), 7.05 (1H, d,  $J = 16.5 \text{ Hz}$ ), 7.10 (1H, d,  $J = 8.4, 2.4 \text{ Hz}$ ), 7.26 (1H, d,  $J = 16.5 \text{ Hz}$ ), 7.33 (2H, d,  $J = 8.4 \text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J = 8.4 \text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J = 2.4 \text{ Hz}$ ).

例 10：化合物番号 10 の化合物の製造

(1) 5-ブromo-N-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-メトキシベンゼンスルホンアミド

5-ブromo-2-メトキシベンゼンスルホンクロリド (857 mg, 3 mmol) をジクロルメタン (6 mL) に溶解し、氷冷、アルゴン雰囲気下に 3, 5-ジクロロアニリン (510 mg, 3.15 mmol)、ピリジン (261 mg, 3.3 mmol) のジクロルメタン (2 mL) を滴下、次いで室温で 6 時間攪拌した。反応混合物をジクロルメタンで希釈し 2 規定塩酸、水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣を n-ヘキサン-酢酸エチル晶析して、標題化合物の白色結晶 (900 mg, 73.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  4.03 (3H, s), 6.92 (1H, d,

$J = 9.0 \text{ Hz}$ ),  $7.01$  ( $2\text{H}$ ,  $d$ ,  $J = 1.8 \text{ Hz}$ ),  $7.07 - 7.08$  ( $1\text{H}$ ,  $m$ ),  $7.24$  ( $1\text{H}$ ,  $brs$ ),  $7.63$  ( $1\text{H}$ ,  $dd$ ,  $J = 8.7$ ,  $2.4 \text{ Hz}$ ),  $7.99$  ( $1\text{H}$ ,  $d$ ,  $J = 2.4 \text{ Hz}$ ).

(2) 5-ブロモ-N-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシベンゼンスルホンアミド (化合物番号 10)

5-ブロモ-N-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-メトキシベンゼンスルホンアミドの白色結晶 ( $206 \text{ mg}$ ,  $0.5 \text{ mmol}$ )、沃化リチウム ( $134 \text{ mg}$ ,  $1 \text{ mmol}$ )、2, 4, 6-コリジン ( $5 \text{ mL}$ ) の混合物をアルゴン雰囲気下に 30 分間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却した後、2 規定塩酸に於て酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣を *n*-ヘキサ-酢酸エチルで晶析して標題化合物の白色結晶 ( $90 \text{ mg}$ ,  $45.3\%$ ) を得た。

$mp$   $158 - 159^\circ\text{C}$ .

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$   $6.92$  ( $1\text{H}$ ,  $d$ ,  $J = 8.7 \text{ Hz}$ ),  $7.11$  ( $2\text{H}$ ,  $d$ ,  $J = 2.1 \text{ Hz}$ ),  $7.21 - 7.22$  ( $1\text{H}$ ,  $m$ ),  $7.62$  ( $1\text{H}$ ,  $dd$ ,  $J = 8.7$ ,  $2.7 \text{ Hz}$ ),  $7.80$  ( $1\text{H}$ ,  $d$ ,  $J = 2.4 \text{ Hz}$ ),  $10.70$  ( $1\text{H}$ ,  $br$ ),  $11.37$  ( $1\text{H}$ ,  $br$ ).

例 11: 化合物番号 11 の化合物の製造

2-アミノフェノール ( $120 \text{ mg}$ ,  $1.1 \text{ mmol}$ ) をジクロロメタン ( $5 \text{ mL}$ ) に溶解し、氷冷、アルゴン雰囲気下に 3, 5-ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイルクロリド ( $300 \text{ mg}$ ,  $1.1 \text{ mmol}$ ) のジクロロメタン ( $3 \text{ mL}$ ) 溶液、ピリジン ( $0.5 \text{ mL}$ ) を滴下し、次いで室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を 2 規定塩酸に於て酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をエタノール ( $5 \text{ mL}$ ) に溶解し、2 規定水酸化ナトリウム ( $0.1 \text{ mL}$ ,  $0.2 \text{ mmol}$ ) を滴下し、次いで室温で 30 分攪拌した。反応混合物を 2 規定塩酸

にあげ酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で精製し、標題化合物の淡桃色結晶（288 mg, 73.6%）を得た。

mp 183°C (dec.).

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-*d*<sub>6</sub>): δ 6.83 (1H, td, J=8.0, 1.2 Hz), 6.93 (1H, dd, J=8.0, 1.2 Hz), 7.08 (1H, td, J=8.0, 1.6 Hz), 7.50 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.35 (2H, s), 9.61 (1H, s), 10.15 (1H, s).

例12：化合物番号12の化合物の製造

2-アミノ-4-クロロフェノール（316 mg, 2.2 mmol）、トリエチルアミン（243 mg, 2.4 mmol）をジクロルメタン（8 mL）に溶解し、氷冷、アルゴン雰囲気下に3, 5-ジクロロベンゾイルクロリド（419 mg, 2 mmol）のジクロルメタン（2 mL）溶液を滴下し、次いで室温で15時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）で精製し、淡褐色固体を得た。これを*n*-ヘキサン-酢酸エチルで加熱還流下に懸濁洗浄して標題化合物の白色結晶（205 mg, 32.4%）を得た。

mp 251-252°C.

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-*d*<sub>6</sub>): δ 6.93 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.11 (1H, dd, J=8.7, 2.7 Hz), 7.67 (2H, d, J=2.7 Hz), 7.86-7.87 (1H, m), 7.97 (1H, d, J=1.8 Hz), 9.85 (1H, s), 10.03 (1H, s).

例13：化合物番号13の化合物の製造

2-アミノ-4-クロロフェノール（287 mg, 2 mmol）、3, 5-ジクロロベンゼンスルホニルクロリド（540 mg, 2.2 mmol）をジクロルメタ



ン (4 mL) に溶解し、氷冷、アルゴン雰囲気下にピリジン (1 mL) を滴下し、次いで室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を 2 規定塩酸にあげ酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 1 → 1 : 1) で精製し、赤褐色固体を得た。これを n-ヘキサン-酢酸エチル晶析して標題化合物の微褐色結晶 (44.5 mg, 63.1%) を得た。

mp 190–191°C.

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ ):  $\delta$  6.68 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.08 (1H, dd,  $J=8.7, 2.7\text{ Hz}$ ), 7.17 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.70 (2H, d,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 7.95–7.96 (1H, m), 10.00 (1H, s), 10.06 (1H, s).

例 14 : 化合物番号 14 の化合物の製造

(1) 4-ブromo-2-[(3, 5-ジクロロフェニルイミノ) メチル] フェノール

5-ブromoサリチルアルデヒド (1.01 g, 5 mmol), 3, 5-ジクロロアニリン (810 mg, 5 mmol)、エタノール (25 mL) の混合物をアルゴン雰囲気下に 1 時間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却後、析出した結晶を濾取して、標題化合物の橙色結晶 (1.52 g, 88.2%) を得た。

mp 161–163°C.

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ ):  $\delta$  6.94 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.16 (2H, d,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 7.30–7.31 (1H, m), 7.47–7.53 (2H, m), 8.51 (1H, s).

(2) N-[(5-ブromo-2-ヒドロキシフェニル) メチル] -3, 5-ジクロロアニリン (化合物番号 14)

4-ブromo-2-[(3, 5-ジクロロフェニルイミノ) メチル] フェノール (1.04 g, 3 mmol) をテトラヒドロフラン (12 mL) 及びエタノール (6 mL)

L)に溶解し、氷冷、アルゴン雰囲気下に水素化ホウ素ナトリウム(113 mg, 3 mmol)を添加し、次いで室温で12時間攪拌した。反応混合物にアセトン(10 mL)を添加し、減圧下に濃縮して得られた残渣に水を加えてジクロルメタンで抽出した。ジクロルメタン層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製し、淡黄色粘稠性物質を得た。これをn-ヘキサンで結晶化して標題化合物の白色結晶(971 mg, 93.3%)を得た。

mp 125–126°C.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  4.31 (2H, s), 6.64 (2H, d,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 6.74–6.77 (1H, m), 6.84–6.85 (1H, m), 7.30–7.34 (2H, m).

例15: 化合物番号15の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元: Sigma-Aldrich社

カタログコード番号: S3203-5

例16: 化合物番号16の化合物の製造

5-クロロサリチル酸(173 mg, 1 mmol)、3,5-ビス(トリフルオロメチル)-N-メチルアニリン(243 mg, 1 mmol)、三塩化リン(44  $\mu\text{l}$ , 0.5 mmol)、モノクロロベンゼン(5 mL)の混合物をアルゴン雰囲気下に3時間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却した後、n-ヘキサン(50 mL)を添加し、析出した粗結晶を濾取して酢酸エチル(50 mL)に溶解した。酢酸エチル溶液を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製し、標題化合物の白色結晶(75 mg, 18.9%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  3.57 (3H, s), 6.59 (1H, d,  $J$

= 2.4 Hz), 6.94 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.21 (1H, dd, J = 9.0, 2.7 Hz), 7.58 (2H, s), 7.80 (1H, s), 10.00 (1H, brs).

以下の実施例において例16の方法が引用されている場合、酸ハロゲン化剤としては、三塩化リンを用いた。また、反応溶媒としては、モノクロロベンゼン、トルエン等の溶媒を用いた。

#### 例17：化合物番号17の化合物の製造

原料として、5-ブロモサリチル酸、及び7-トリフルオロメチル-1,2,3,4-テトラヒドロキノリンを用いて例16と同様の操作を行い、標題化合物を得た。

収率：42.0%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  2.08 (2H, m), 2.92 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.95 (2H, t, J = 6.6 Hz), 6.91–6.94 (2H, m), 7.14 (1H, s), 7.32–7.35 (2H, m), 7.40 (1H, dd, J = 8.7, 2.4 Hz), 10.06 (1H, s).

#### 例18：化合物番号18の化合物の製造

原料として、2-ヒドロキシナフタレン-1-カルボン酸、及び3,5-ジクロロアニリンを用いて例16と同様の操作を行い、標題化合物を得た。

収率：51.2%

mp 246–248°C.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  7.26 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.31–7.37 (2H, m), 7.44–7.50 (1H, m), 7.65–7.68 (1H, m), 7.85–7.90 (4H, m), 10.23 (1H, s), 10.74 (1H, s).

#### 例19：化合物番号19の化合物の製造

原料として、3-ヒドロキシナフタレン-2-カルボン酸、及び3,5-ジクロロアニリンを用いて例16と同様の操作を行い、標題化合物を得た。

収率：44.3%

mp 254-255°C.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  7.34-7.39 (3H, m), 7.49-7.54 (1H, m), 7.76-7.79 (1H, m), 7.89 (2H, d,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, m), 8.39 (1H, s), 10.75 (1H, s), 11.01 (1H, s).

例20：化合物番号20の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元：Sigma-Aldrich社

カタログコード番号：S01361-8

例21：化合物番号21の化合物の製造

原料として、1-ヒドロキシナフタレン-2-カルボン酸、及び3,5-ビス(トリフルオロメチル)アニリンを用いて例16と同様の操作を行い、標題化合物を得た。

収率：65.5%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  7.51 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, td,  $J=7.8, 0.9\text{ Hz}$ ), 7.70 (1H, td,  $J=7.8, 0.9\text{ Hz}$ ), 7.89 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 8.09 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 8.51 (2H, s), 10.92 (1H, s), 13.36 (1H, s).

例22：化合物番号22の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元：Sigma-Aldrich社

カタログコード番号：S58026-0

例23：化合物番号23の化合物

本化合物は、市販化合物である。

販売元：Sigma-Aldrich社

カタログコード番号：S 6 3 2 6 3 - 5

例 2 4：化合物番号 2 4 の化合物の製造

5-クロロ-2-ヒドロキシニコチン酸 (174 mg, 1 mmol)、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)アニリン (275 mg, 1.2 mmol)、ピリジン (316 mg, 4 mmol) をテトラヒドロフラン (20 mL) 及びジクロロメタン (10 mL) に溶解し、オキシ塩化リン (0.112 mL, 1.2 mmol) を添加し、次いで室温で2時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル (100 mL) 及び0.2規定塩酸 (100 mL) にあけ、30分間攪拌したあとにセライトろ過紙、濾液の水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた酢酸エチル層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1→1：1) で精製し、淡黄色固体を得た。これをエタノールで加熱還流下に懸濁洗浄して標題化合物の白色結晶 (183 mg, 47.6%) を得た。

融点：> 270℃

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  7.83 (1H, s), 8.15 (1H, d,  $J=3.3\text{ Hz}$ ), 8.36 (1H, d,  $J=3.0\text{ Hz}$ ), 8.40 (2H, s), 12.43 (1H, s).

以下の実施例において例 2 4 の製造法が引用されている場合、酸ハロゲン化剤としては、オキシ塩化リンを用いた。塩基としては、ピリジンを用いた。また、反応溶媒としては、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン等の溶媒を単独若しくは混合して用いた。

例 2 5：化合物番号 2 5 の化合物の製造

原料として、5-クロロ-2-ヒドロキシニコチン酸、及び2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)アニリンを用いて例 2 4 と同様の操作を行い、標題化合物を得た。

収率：42.9%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  7.52 (1H, dd,  $J=8.4, 2.$

1 Hz), 7.81 (1H, d,  $J=8.4$  Hz), 8.16 (1H, s), 8.39 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 8.96 (1H, d,  $J=2.1$  Hz), 12.76 (1H, s), 13.23 (1H, s).

例 26 : 化合物番号 26 の化合物の製造

原料として、5-クロロ-2-ヒドロキシニコチン酸、及び 3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] アニリンを用いて例 24 と同様の操作を行い、標題化合物を得た。

収率 : 59.1%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ ) :  $\delta$  1.29 (18H, s), 7.18 (1H, t,  $J=1.8$  Hz), 7.52 (2H, d,  $J=1.8$  Hz), 8.07 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 8.35 (1H, d,  $J=3.3$  Hz), 11.92 (1H, s), 13.10 (1H, s).

例 27 : 化合物番号 27 の化合物の製造

原料として、3-ヒドロキシピリジン-2-カルボン酸、及び 3, 5-ビス (トリフルオロメチル) アニリンを用いて例 24 と同様にして、標題化合物を得た。

収率 : 45.0%

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ ) :  $\delta$  7.40 (1H, dd,  $J=8.4, 1.8$  Hz), 7.46 (1H, dd,  $J=8.4, 4.2$  Hz), 7.68 (1H, s), 8.16 (1H, dd,  $J=4.2, 1.2$  Hz), 8.25 (2H, s), 10.24 (1H, s), 11.42 (1H, s).

例 28 : 化合物番号 28 の化合物の製造

アルゴン雰囲気下、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニルイソシアネート (255 mg, 1.0 mmol) をテトラヒドロフラン (5 mL) に溶解し、6-クロロ-オキシインドール (184 mg, 1.1 mmol) のテトラヒドロフラン (5 mL) 溶液、トリエチルアミン (0.3 mL) を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧留去して得られた